This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents *will not* correct images, please do not report the images to the Image Problem Mailbox.

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2002 年7 月11 日 (11.07.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/053565 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K 31/437, 31/519, A61P 1/00, 1/04, 1/08, 1/14, 3/04, 3/08, 5/14, 9/00, 9/02, 9/06, 9/10, 9/12, 11/06, 17/06, 19/02, 19/10, 25/00, 25/06, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 27/02, 29/00, 37/08, 43/00 // (C07D 487/14, 207:00, 231:00, 239:00) (C07D 491/147, 231:00, 239:00, 307:00) (C07D 495/14, 231:00, 239:00, 333:00)

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/11581

(22) 国際出願日: 2001 年12 月27 日 (27.12.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2000-402517
2000 年12 月28 日 (28.12.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修町２丁目１番５号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中井 久郎 (NAKAI,Hisao) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井３丁目１番１号 小野薬品工業株式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP). 鏡石 佳史 (KAGAMI-ISHI,Yoshifumi) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井３丁目１番１号 小野薬品工業株式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE,Kunihisa); 〒103-0013 東京都 中央区 日本橋人形町２丁目２番６号 堀口第２ビル７階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

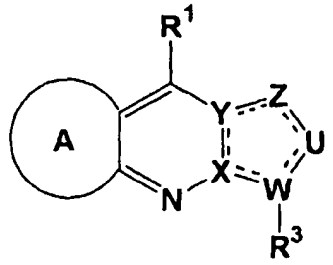
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: TRICYCLIC AND HETEROCYCLIC DERIVATIVE COMPOUNDS AND DRUGS CONTAINING THESE COMPOUNDS AS THE ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: 三環式複素環誘導体化合物およびその化合物を有効成分とする医薬



(I)

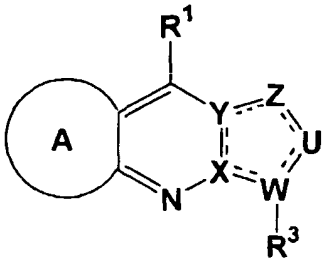
(57) Abstract: Tricyclic and heterocyclic derivatives represented by the following general formula (I) and pharmaceutically acceptable salts thereof; a process for producing the same; and drugs containing the same as the active ingredient: (I) wherein W, X and Y represent each carbon or nitrogen; U and Z represent each CR^2, NR^{13}, nitrogen, oxygen, sulfur, etc.; the ring A represents a carbon ring or a heterocycle; R^1 represents alkyl, alkenyl, alkynyl, NR^4R^5, OR^6, etc.; and R^3 represents a carbon ring or a heterocycle. Because of having a corticotropin release factor receptor antagonism, the compounds represented by the general formula (I) are useful in preventing and/or treating depression, anxiety, eating disorder, post-traumatic stress, digestive ulcer, irritable bowel syndrome, Alzheimer's disease, alcoholic or drug withdrawal, etc.

[続葉有]

WO 02/053565 A1

(57) 要約:

一般式（Ｉ）で示される三環式複素環誘導体、およびその薬学的に許容される塩、それらの製造方法、それらを有効成分として含有する薬剤［式中、Ｗ、Ｘ、Ｙは炭素または窒素原子；Ｕ、ＺはＣＲ^{2}、ＮＲ^{13}、窒素、酸素、硫黄原子等；Ａ環は炭素環、複素環；Ｒ^{1}はアルキル、アルケニル、アルキニル、ＮＲ^{4}Ｒ^{5}、ＯＲ^{6}等；Ｒ^{3}は炭素環、複素環を表わす。］。



(I)

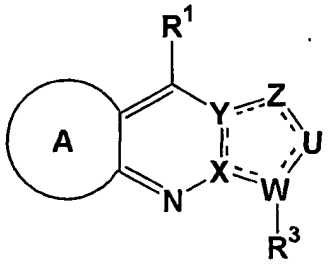
一般式（Ｉ）で示される化合物はコルチコトロピン放出因子受容体拮抗作用を有するため、うつ病、不安障害、摂食異常、心的外傷後ストレス、消化性潰瘍、過敏性大腸症候群、アルツハイマー病、薬物またはアルコールの禁断症状等等の予防及び／または治療に有用である。

明　細　書

三環式複素環誘導体化合物およびその化合物を有効成分とする医薬

技術分野

本発明は、医薬として有用な一般式（Ｉ）



(I)

（式中、すべての記号は後記と同じ意味を表わす。）で示される三環式複素環誘導体化合物、およびその化合物を有効成分とする医薬に関する。

背景技術

コルチコトロピン放出因子（Corticotropin Releasing Factor：ＣＲＦ）は、1981年にヒツジ視床下部から単離された４１個のアミノ酸ペプチドである。このＣＲＦは視床下部から放出され、脳下垂体からの副腎皮質ホルモン（ＡＣＴＨ）の分泌調節を担っていることが示唆された［Science, 218, 377-379(1982)］。

生物学的効果は、まず放出されたＣＲＦが下垂体前葉のＡＣＴＨ産生細胞などの膜表面に存在するＣＲＦレセプターへの結合から始まる。ＣＲＦレセプターには２つのサブタイプのレセプターが存在し、それぞれ脳内の異なった領域に分布していることが明らかになっている。例えば、レセプター１は下垂体、視床下部、大脳皮質等に存在し、レセプター２は主脳の中隔、視床下部室傍核等に存在する。またレセプターは末梢臓器、例えば、心臓、胃腸、肺、副腎髄質、脾臓、肝臓、腎臓、前立腺等にも存在する。具体的には、腸

または脾臓にはレセプター１、胃にはレセプター２が多く存在し、心臓、骨格筋にはレセプター２のうちでも２βが多く存在する。

ＣＲＦの刺激によって分泌されたＡＣＴＨは、副腎皮質からのコルチゾールの分泌を刺激しており、生殖、成長、胃腸機能、炎症、免疫系、神経系等に対する全身的な作用に関連する。よって、ＣＲＦはこれらの機能の調節因子として働くと考えられている。

実際、ＣＲＦがうつ病、不安障害の患者において脳で過剰分泌されているとの報告がある［Science, 226, 1342-1343 (1984); Neuroscience and Behavioral Reviews, 22, 635-651 (1998); J. Endocrinol., 160, 1-12 (1999)］。

また、これら以外にも、ＣＲＦと種々の疾患の関係が報告されている。例えば、摂食異常［Science, 273, 1561-1564 (1996)］、炎症［Endocrinology, 137, 5747-5750 (1996)］、過敏性腸症候群［Am. J. Physiol, 253, G582-G586 (1987)］、薬物依存［Psychopharmacology 137, 184-190 (1998)］、または虚血［Soc Neurosci Abstr (Nov 4-9, New Orleans), 807.5 (2000)］等がある。

一方、ＣＲＦはストレスにも深く関わっている。例えば、ＣＲＦを脳内に投与するとストレス環境にさらされた動物と同様の行動、内分泌応答等が見られる［Nature, 297, 331 (1982)］。

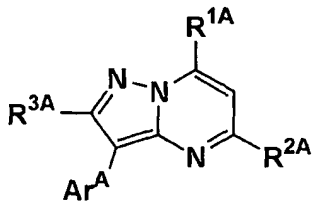
これらのことよりＣＲＦの中枢神経系や精神神経系疾患、また末梢臓器の疾患への関与が注目されている。

従って、ＣＲＦ受容体に拮抗することは、ＣＲＦの分泌異常による疾患、例えばストレス関連疾患を含む多様な障害または疾病に有効である。例えば、うつ病、単一エピソードうつ病、再発性うつ病、分娩後うつ病、小児虐待誘発性うつ病、不安症、不安障害（パニック障害、特定の恐怖症、高所恐怖症、社会恐怖、強迫性障害）、感情障害、双極性障害、心的外傷後ストレス（ＰＴＳＤ）、消化性潰瘍、下痢、便秘、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患（潰瘍性大腸炎、クローン病）、ストレスに伴う胃腸機能障害、神経性嘔吐、摂食

異常（神経性食欲不振、過食症）、肥満症、ストレス誘発性睡眠障害、繊維筋痛性睡眠障害、ストレス誘導性免疫抑制、ストレス誘発性頭痛、ストレス誘発性熱、ストレス誘発性疼痛、手術襲撃ストレス、慢性関節リウマチ、変形性骨関節症、骨粗鬆症、乾癬、甲状腺機能障害症候群、ブドウ膜炎、喘息、不適切な抗下痢ホルモンに基づく症状、疼痛、炎症、アレルギー性疾患、頭部損傷、脊髄損傷、虚血性ニューロン損傷、分泌毒性ニューロン損傷、クッシング病、発作、痙攣、筋痙攣、てんかん虚血性疾患、パーキンソン病、ハンティングトン病、尿失禁、アルツハイマー病、アルツハイマー型老人性痴呆、多梗塞性痴呆症、筋萎縮性側索硬化症、低血糖症、心血管または心臓関連疾患（高血圧、頻脈、うっ血性心不全）、薬物またはアルコールの禁断症状等の疾患等の予防および／または治療に有効であると考えられる。

一方、ＣＲＦに対し拮抗作用を有する化合物として、例えば以下のものが知られている。

（１）WO97/29109 号明細書には、一般式（A）



(A)

（式中、R^{1A}は$NR^{4A}R^{5A}$、またはOR^{5A}であり、

R^{2A}はアルキル、アルキルオキシ、アルキルチオであり、

R^{3A}はH、アルキル、アルキルスルホニル、アルキルスルホキシ、アルキルチオであり、

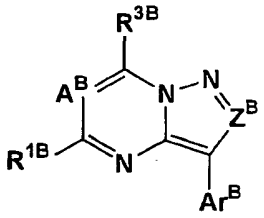
R^{4A}はH、アルキル、モノーもしくはジ（シクロアルキル）メチル、シクロアルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルカルボニルオキシアルキル、またはアルキルオキシアルキルであり、

R^{5A}はアルキル、モノーもしくはジ（シクロアルキル）メチル、Ar^{1A}－Ｃ

H_2、アルケニル、アルキルオキシアルキル、ヒドロキシアルキル、チエニルメチル、フラニルメチル、アルキルチオアルキル、モルホリニル等であり、あるいはR^{4A}およびR^{5A}はそれらが結合している窒素原子と一緒になって、アルキル、アルキルオキシアルキルで置換されていることができるピロリジニル、ピペリジニル、ホモピペリジニル、モルホリニル基を形成することができ、

Ar^Aはフェニル、ハロ、アルキル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ等から選ばれる1，2もしくは3個の置換基で置換されたフェニル、ピリジニル、ハロ、アルキル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ等から選ばれる1，2もしくは3個の置換基で置換されたフェニルピリジニルである。）で示される化合物がCRF受容体拮抗薬として開示されている。

（2）WO98/03510号明細書には、一般式（B）



(B)

（式中、A^BはNまたはCR^Bであり、

Z^BはNまたはCR^{2B}であり、

Ar^Bはフェニル、ナフチル、ピリジル、ピリミジニル、トリアジニル、フラニル、チエニル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル等を表わし、それぞれ1～5個のR^{4B}で置換されていてもよく、

R^BはH、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン原子、シアノ、ハロアルキルを表わし、

R^{1B}はH、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン原子、シアノ、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル等を表わし、

R^{2B}はH、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロア

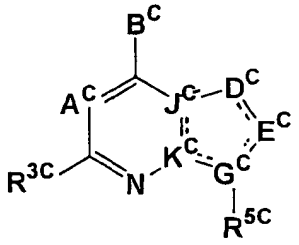
ルキルアルキル、ヒドロキシアルキル等を表わし、

R^{3B}はH、OR^{7B}、SH、S（O）nR^{13B}、COR^{7B}、CO_2R^{7B}、OC（O）R^{13B}、$NR^{8B}COR^{7B}$、N（COR^{7B}）$_2$、$NR^{8B}CONR^{6B}R^{7B}$、$NR^{8B}CO_2R^{13B}$、$NR^{6B}R^{7B}$、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル等を表わし、

R^{4B}はアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、NO_2、ハロゲン原子、シアノ、ハロアルキル、$NR^{6B}R^{7B}$、$NR^{8B}COR^{7B}$等を表わす。）

で示される化合物がＣＲＦ受容体拮抗薬として開示されている。

（３）WO98/08847 号明細書には、一般式（C）



(C)

（式中、点線は任意の二重結合を表わし、

A^Cは窒素またはCR^{7C}を表わし、

B^Cは$NR^{1C}R^{2C}$、$CR^{1C}R^{2C}R^{10C}$、C（$=CR^{2C}R^{11C}$）R^{1C}、$NHCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$、$OCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$、$SCR^{1C}R^{2C}R^{10C}$、$CR^{2C}R^{10C}NHR^{1C}$、$CR^{2C}R^{10C}OR^{1C}$、$CR^{2C}R^{10C}SR^{1C}$またはCOR^{2C}を表わし、

J^CおよびK^Cはそれぞれ独立して、窒素または炭素であり、両方ともが窒素であることはなく、

D^CおよびE^Cはそれぞれ独立して、窒素、CR^{4C}、C＝O、C＝S、硫黄、酸素、$CR^{4C}R^{6C}$およびNR^{8C}から選択され、

G^Cは窒素または炭素であり、

D^C、E^C、G^C、K^C、およびJ^Cを含む環は飽和または不飽和の５員環であってよく、所望により１または２個の二重結合を含んでいてもよく、所望により環中に１～３個の異種原子を含んでいてもよく、かつ所望により１または２個のＣ＝ＯまたはＣ＝Ｓを含んでいてもよく、

R^{1C}はヒドロキシ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、Ｏ－アルキル、CF_3、Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－アルキル、ＯＣ（＝Ｏ）アルキル等から選択される１または２個の置換基で所望により置換されたアルキルであり、

R^{2C}は所望により１～３個の二重結合または三重結合を含んでいてもよいアルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル等であり、

R^{3C}はH、アルキル、Ｏ－アルキル、クロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、アルキレン－Ｏ－アルキル、アルキレン－ＯＨ、またはＳ－アルキルであり、

R^{4C}はH、アルキル、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、アルキレン－ＯＨ、CF_3等であり、

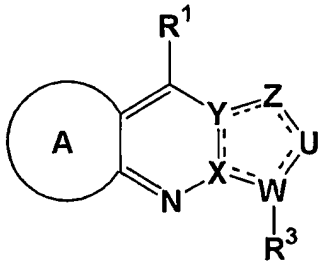
R^{5C}はフェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジル、ピリダジニルであり、それぞれ１～４個の置換基R^{13C}で置換されており、それらの置換基の内１～３個はフルオロ、クロロ、アルキルおよびＯ－アルキルから選択することができ、それらの置換基の内１個はブロモ、ヨード、ホルミル、ＯＨ、アルキレン－ＯＨ、アルキレン－Ｏ－アルキル、シアノ、CF_3、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ等である。）

で示される化合物がＣＲＦ受容体拮抗薬として開示されている。

発明の開示

本発明は、三環式複素環誘導体に関する。

詳しくは、本発明は、（１）一般式（Ｉ）



(I)

(式中、

XおよびYはそれぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表わし（ただし、二つは同時に窒素原子を表わさない。）、

Wは炭素原子または窒素原子を表わし、

UおよびZはそれぞれ独立して、CR^2、NR^{13}、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、C＝OまたはC＝Sを表わし、

R^2は

(i)水素原子、

(ii)C１～８アルキル、

(iii)C２～８アルケニル、

(iv)C２～８アルキニル、

(v)ハロゲン原子、

(vi)CF_3、

(vii)シアノ、

(viii)ニトロ、

(ix)NR^9R^{10}（基中、R^9およびR^{10}はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

(ii)C１～４アルキル、

(iii)C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(iv)１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(v) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、もしくは１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(x) OR^{11} （基中、R^{11}は

(i) 水素原子、

(ii) Ｃ１～４アルキル、

(iii) Ｃ５～６の炭素環、

(iv) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(v) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xi) ＳＨ、

(xii) $S(O)_nR^{12}$ （基中、ｎは０、１または２を表わし、R^{12}は

(i) Ｃ１～４アルキル、

(ii) Ｃ５～６の炭素環、

(iii) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(iv) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii) COR^{11}、

(xiv) $COOR^{11}$、

(xv) $CONR^{9}R^{10}$、

(xvi) Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(xvii) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または

(xviii) ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、C3～10の単環もしくは二環式炭素環、および1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC1～4アルキルを表わし、

R^{13}は

(i) 水素原子、

(ii) C1～4アルキル、

(iii) C2～4アルケニル、

(iv) C2～4アルキニル、

(v) C3～10の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii) C3～10の単環もしくは二環式炭素環で、または1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環で置換されているC1～4アルキルを表わし、

---- は単結合または二重結合を表わし、



はC1～4アルキル、C1～4アルコキシ、ハロゲン原子およびCF_3から選ばれる基1～3個で置換されているか、もしくは無置換のC4～6炭素環、または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも1個含有する4～6員の複素環を表わし、

R^1は

(i) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC1～8アルキル、

(ii) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC2～8アルケニル、

(iii) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC2～8アルキニル、

(iv) NR^4R^5（基中、R^4およびR^5はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

(ii) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC1～15アルキル、

(iii) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルケニル、

(iv) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルキニル、

(v) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環を表わす。）、

(v) OR^6（基中、R^6は

(i)水素原子、

(ii) C1～10アルキル、

(iii) C2～10アルケニル、

(iv) C2～10アルキニル、

(v) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、ＣＦ$_3$、ＯＣＦ$_3$、シアノ、ニトロ、ＮＲ^{9}Ｒ^{10}、ＯＲ^{11}、＝Ｎ－ＯＲ^{11}、ＳＨ、Ｓ(Ｏ)$_n$Ｒ^{12}、ＣＯＲ^{11}、ＣＯＯＲ^{11}、ＣＯＮＲ^{9}Ｒ^{10}、１～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(vi) ＳＨ、

(vii) Ｓ(Ｏ)$_n$Ｒ^7（基中、ｎは前記と同じ意味を表わし、Ｒ^{7}は

(i) Ｃ１～８アルキル、

(ii) １～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(iii) １～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(iv) １～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、または１～５個のＲ^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(viii) ＣＯＲ^6、

(ix) ＣＯＯＲ^6、

(x) $CONR^4R^5$、

(xi) NR^8COR^{6a}（基中、R^{6a}は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～１０アルキル、

(iii)Ｃ２～１０アルケニル、

(iv)Ｃ２～１０アルキニル、

(v)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11a}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、および$CONR^9R^{10}$から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xii) NR^8COOR^6（基中、R^6は前記と同じ意味を表わし、R^8は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～８アルキル、

(iii)Ｃ２～８アルケニル、

(iv)Ｃ２～８アルキニル、

(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環も

しくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii)$NR^8CONR^4R^5$、

(xiv)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または

(xv)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{11a}は(i)水素原子、(ii)Ｃ１～４アルキル、または(iii)Ｃ５～６の炭素環または１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わし、

R^{14}は(a)ハロゲン原子、(b)CF_3、(c)OCF_3、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)NR^4R^5、(g)OR^6、(h)＝Ｎ－OR^6、(j)ＳＨ、(k)$S(O)_nR^7$、(l)COR^6、(m)$COOR^6$、(n)$CONR^4R^5$、(o)NR^8COR^6、(p)NR^8COOR^6、(q)$NR^8CONR^4R^5$、(r)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(s)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{15}は(a)Ｃ１～８アルキル、(b)Ｃ２～８アルケニル、(c)Ｃ２～８アルキニル、(d)Ｃ１～４アルコキシ（Ｃ１～４）アルキル、(e)ハロゲン原子、(f)CF_3、(g)OCF_3、(h)シアノ、(j)ニトロ、(k)NR^4R^5、(l)OR^6、(m)ＳＨ、(n)$S(O)_nR^7$、(o)COR^6、(p)$COOR^6$、(q)$CONR^4R^5$、(r)NR^8COR^6、(s)NR^8COOR^6、(t)$NR^8CONR^4R^5$、(u)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、(v)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の

窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、(w)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^4R^5、OR^6、$=N-OR^6$、SH、$S(O)_nR^7$、COR^6、$COOR^6$、$CONR^4R^5$、NR^8COR^6、NR^8COOR^6、$NR^8CONR^4R^5$、１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わし、

R^{17}は(a)ハロゲン原子、(b)CF_3、(c) OCF_3、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)NR^9R^{10}、(g)OR^{11a}、(h)$=N-OR^{11}$、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)COR^{11}、(m)$COOR^{11}$、(n)$CONR^9R^{10}$、(o)NR^8COR^{11}、(p)NR^8COOR^{11}、(q)$NR^8CONR^9R^{10}$、(r)１～５個のR^{18a}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(s)１～５個のR^{18a}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{18}は(a)Ｃ１～４アルキル、(b)Ｃ２～４アルケニル、(c)Ｃ２～４アルキニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF_3、(f)OCF_3、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)NR^9R^{10}、(m)OR^{11}、(n)COR^{11}、(o)$COOR^{11}$、(p)$CONR^9R^{10}$、(q)Ｃ５～６の炭素環、(r)１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または(s)Ｃ５～６の炭素環または１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルで置換されたＣ１～４アルキル表わし、

R^{18a}は(a)Ｃ１～４アルキル、(b)Ｃ２～４アルケニル、(c)Ｃ２～４アル

キニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF_3、(f)OCF_3、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)NR^9R^{10}、(m)OR^{11a}、(n)COR^{11}、(o)$COOR^{11}$、または(p)$CONR^9R^{10}$を表わし、

R^{19}はC1～4アルキル、C1～4アルコキシ、ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、アミノ、NH（C1～4アルキル）、またはN（C1～4アルキル）$_2$を表わし、

R^3は(i)1～5個のR^{16}によって置換されているC5～10の単環もしくは二環式炭素環、または

(ii)1～5個のR^{16}によって置換されている1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する5～10員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{16}は、

(a)C1～8アルキル、

(b)C2～8アルケニル、

(c)C2～8アルキニル、

(d)ハロゲン原子、

(e)CF_3、

(f)OCF_3、

(g)シアノ、

(h)ニトロ、

(j)NR^9R^{10}、

(k)OR^{11}、

(l)SH、

(m)$S(O)_nR^{12}$（ただし、フェニルチオは除く）、

(n)COR^{11}、

(o)$COOR^{11}$、

(p)$CONR^9R^{10}$、

(q)NR^8COR^{11}、

(r)NR^8COOR^{11}、

(s)$NR^8CONR^9R^{10}$、

(t)Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(u)１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(v)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、NR^8COR^{11}、NR^8COOR^{11}、$NR^8CONR^9R^{10}$、Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。

ただし、（１）XおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子、UがCR^4、かつR^1がOR^6を表わすとき、R^3は１個のハロゲンで置換されたフェニル、１個のトリフルオロメチルで置換されたフェニル、トリフルオロメチルおよびニトロで置換されたフェニルは表わさず、（２）X、YおよびZが炭素原子であり、UおよびWが窒素原子の時、R^3は１～５個のR^{16}によって置換されているＣ５～１０の単環もしくは二環式炭素環である。）

で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物、

（２）それらの製造方法、および

（３）それらを含有するＣＲＦ受容体拮抗剤に関する。

本明細書中で用いるＣ１～４アルキルとは、メチル、エチル、プロピル、ブチル基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ１～８アルキルとは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ１～１５アルキルとは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ１～４アルコキシとは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ２～４アルケニルとは、ビニル、プロペニル、ブテニル基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ２～８アルケニルとは、１～３個の二重結合を有するエチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル基およびこれらの異性体を意味する。例えば、ビニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘキサジエニル、ヘプテニル、ヘプタジエニル、オクテニル、オクタジエニル基等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ２～１５アルケニルとは、１～３個の二重結合を有するエチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル基およびこれらの異性体を意味する。例えば、ビニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘキサジエニル、ヘプテニル、ヘプタジエニル、オクテニル、オクタジエニル、ノネニル、ノナジエニル、デセニル、デカジエニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル基等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ２～４アルキニルとは、エチニル、プロピニル、ブチニルおよびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ２～８アルキニルとは、１～３個の三重結合を有するエチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル基およびこれらの異性体を意味する。例えば、エチニル、プロピニル、ブチニ

ル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘキサジエニル、ヘプチニル、ヘプタジエニル、オクチニル、オクタジエニル基等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ２～１５アルキニルとは、１～３個の三重結合を有するエチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル基およびこれらの異性体を意味する。例えば、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘキサジエニル、ヘプチニル、ヘプタジエニル、オクチニル、オクタジエニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル基等が挙げられる。

本明細書中で用いるハロゲン原子とはフッ素、塩素、臭素およびヨウ素である。

本明細書中で用いるＣ１～４アルコキシ（Ｃ１～４）アルキルとは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ基およびこれらの異性体基１個で置換されているメチル、エチル、プロピル、ブチル基およびこれらの異性体を意味する。

本明細書中で用いるＣ４～６炭素環には、Ｃ４～６の炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、ベンゼン環等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ５～６炭素環とは、Ｃ５～６の炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、ベンゼン環等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環には、Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、シクロプロパン、シクロブタン、シクロ

ペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、ベンゼン、ペンタレン、インデン、ナフタレン、アズレン、パーヒドロペンタレン、インダン、パーヒドロインデン、テトラヒドロナフタレン、パーヒドロナフタレン、パーヒドロアズレン環等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環には、Ｃ３～１５の単環もしくは二環式炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したもの、または架橋した二環炭素環が含まれる。例えば、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、ベンゼン、ペンタレン、インデン、ナフタレン、アズレン、ヘプタレン、パーヒドロペンタレン、インダン、パーヒドロインデン、テトラヒドロナフタレン、パーヒドロナフタレン、パーヒドロアズレン、パーヒドロヘプタレン、ビシクロ［３．１．１］－ヘプタン環等が挙げられる。

本明細書中で用いるＣ５～１０の単環もしくは二環式炭素環には、Ｃ５～１０の単環もしくは二環式炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロヘプテン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタジエン、ベンゼン、ペンタレン、インデン、ナフタレン、アズレン、パーヒドロペンタレン、インダン、パーヒドロインデン、テトラヒドロナフタレン、パーヒドロナフタレン、パーヒドロアズレン環等が挙げられる。

本明細書中で用いる窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環には、窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、アゼチジン、ピロリジン、ピロリン、

ピロール、テトラヒドロフラン、ジヒドロフラン、フラン、テトラヒドロチオフェン、ジヒドロチオフェン、チオフェン、ピペリジン、ジヒドロピリジン、ピリジン、テトラヒドロピラン、ジヒドロピラン、ピラン、テトラヒドロチオピラン、ジヒドロチオピラン、チオピラン等が挙げられる。

本明細書中で用いる１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５～６員の複素環には、１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５～６員の複素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが含まれる。例えば、ピロール、イミダゾール、ピラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、フラン、ピラン、チオフェン、チアイン（チオピラン）、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、ピロリン、ピロリジン、ピペリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラゾリジン、ピペラジン、パーヒドロピリミジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロチアイン、モルホリン、チオモルホリン等が挙げられる。

本明細書中で用いる１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環には、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環アリール、またはその一部もしくは全部飽和したものが含まれる。

前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環アリールとしては、ピロール、イミダゾール、ピラゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラン、オキセピン、チオフェン、チアイン（チオピラン）、チエ

ピン、オキサゾール、イソオキサゾール、オキサジアゾール、オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアゾール、イソチアゾール、チアジアゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドール、イソインドール、インドリジン、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオフェン、イソベンゾチオフェン、インダゾール、キノリン、イソキノリン、キノリジン、フタラジン、ナフチリジン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、ベンゾオキサゾール、ベンゾオキサジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、ベンゾフラザン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾトリアゾール環等が挙げられる。

前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環アリールの一部もしくは全部飽和したものとしては、アジリジン、アゼチン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラゾリジン、トリアゾリン、トリアゾリジン、テトラゾリン、テトラゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、オキシラン、オキセタン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロオキセピン、テトラヒドロオキセピン、パーヒドロオキセピン、チイラン、チエタン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、ジヒドロチアイン（ジヒドロチオピラン）、テトラヒドロチアイン（テトラヒドロチオピラン）、ジヒドロチエピン、テトラヒドロチエピン、パーヒドロチエピン、オキサゾリン（ジヒドロオキサゾール）、オキサゾリジン（テトラヒドロオキサゾー

ル）、ジヒドロイソオキサゾール、テトラヒドロイソオキサゾール、オキサジアゾリン（ジヒドロオキサジアゾール）、オキサジアゾリジン（テトラヒドロオキサジアゾール）、チアゾリン（ジヒドロチアゾール）、チアゾリジン（テトラヒドロチアゾール）、ジヒドロイソチアゾール、テトラヒドロイソチアゾール、モルホリン、チオモルホリン、インドリン、イソインドリン、ジヒドロベンゾフラン、パーヒドロベンゾフラン、ジヒドロイソベンゾフラン、パーヒドロイソベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、パーヒドロベンゾチオフェン、ジヒドロイソベンゾチオフェン、パーヒドロイソベンゾチオフェン、ジヒドロインダゾール、パーヒドロインダゾール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロキノリン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、パーヒドロイソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パーヒドロフタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキサリン、ジヒドロキナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、パーヒドロキナゾリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒドロシンノリン、ジヒドロベンゾオキサゾール、パーヒドロベンゾオキサゾール、ジヒドロベンゾチアゾール、パーヒドロベンゾチアゾール、ジヒドロベンゾイミダゾール、パーヒドロベンゾイミダゾール、ジオキソラン、ジオキサン、ジオキサジン、ジオキサインダン、クロマン、イソクロマン環等が挙げられる。

本明細書中で用いる１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環には、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環アリール、またはその一部もしくは全部飽和したものが含まれる。

前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２

個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環アリールとしては、ピロール、イミダゾール、ピラゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラン、オキセピン、チオフェン、チアイン（チオピラン）、チエピン、オキサゾール、イソオキサゾール、オキサジアゾール、オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアゾール、イソチアゾール、チアジアゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドール、イソインドール、インドリジン、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオフェン、イソベンゾチオフェン、インダゾール、キノリン、イソキノリン、キノリジン、フタラジン、ナフチリジン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、ベンゾオキサゾール、ベンゾオキサジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、ベンゾアゼピン、ベンゾジアゼピン、ベンゾトリアゾール、ベンゾオキサゼピン、ベンゾオキサジアゼピン、ベンゾチアゼピン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾチアジアゼピン、ベンゾフラザン環等が挙げられる。

前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環アリールの一部もしくは全部飽和したものとしては、アジリジン、アゼチン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラゾリジン、トリアゾリン、トリアゾリジン、テトラゾリン、テトラゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、オキシラン、オキセタン、ジヒドロフラン、テ

トラヒドロフラン、ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロオキセピン、テトラヒドロオキセピン、パーヒドロオキセピン、チイラン、チエタン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、ジヒドロチアイン（ジヒドロチオピラン）、テトラヒドロチアイン（テトラヒドロチオピラン）、ジヒドロチエピン、テトラヒドロチエピン、パーヒドロチエピン、オキサゾリン（ジヒドロオキサゾール）、オキサゾリジン（テトラヒドロオキサゾール）、ジヒドロイソオキサゾール、テトラヒドロイソオキサゾール、オキサジアゾリン（ジヒドロオキサジアゾール）、オキサジアゾリジン（テトラヒドロオキサジアゾール）、チアゾリン（ジヒドロチアゾール）、チアゾリジン（テトラヒドロチアゾール）、ジヒドロイソチアゾール、テトラヒドロイソチアゾール、モルホリン、チオモルホリン、インドリン、イソインドリン、ジヒドロベンゾフラン、パーヒドロベンゾフラン、ジヒドロイソベンゾフラン、パーヒドロイソベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、パーヒドロベンゾチオフェン、ジヒドロイソベンゾチオフェン、パーヒドロイソベンゾチオフェン、ジヒドロインダゾール、パーヒドロインダゾール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロキノリン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、パーヒドロイソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パーヒドロフタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキサリン、ジヒドロキナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、パーヒドロキナゾリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒドロシンノリン、ジヒドロベンゾオキサゾール、パーヒドロベンゾオキサゾール、ジヒドロベンゾチアゾール、パーヒドロベンゾチアゾール、ジヒドロベンゾイミダゾール、パーヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロベンゾアゼピン、テトラヒドロベンゾアゼピン、ジヒドロベンゾジアゼピン、テトラヒドロベンゾジアゼピン、ジヒド

ロベンゾオキサゼピン、テトラヒドロベンゾオキサゼピン、ジオキソラン、ジオキサシン、ジオキサジン、ジオキサインダン、クロマン、イソクロマン環等が挙げられる。

本明細書中で用いる１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する５～１０員の単環もしくは二環式複素環には、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する５～１０員の単環もしくは二環式複素環アリール、またはその一部もしくは全部飽和したものが含まれる。

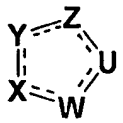
前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する５～１０員の単環もしくは二環式複素環アリールとしては、ピロール、イミダゾール、ピラゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラン、オキセピン、チオフェン、チアイン（チオピラン）、チエピン、オキサゾール、イソオキサゾール、オキサジアゾール、オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアゾール、イソチアゾール、チアジアゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドール、イソインドール、インドリジン、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオフェン、イソベンゾチオフェン、インダゾール、キノリン、イソキノリン、キノリジン、フタラジン、ナフチリジン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、ベンゾオキサゾール、ベンゾオキサジアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、ベンゾフラザン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾトリアゾール環等が挙げられる。

前記した１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する５～１０員の単環もしくは二環式複素環アリールの一部もしくは全部飽和したものとしては、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラゾリジン、トリアゾリン、トリア

ゾリジン、テトラゾリン、テトラゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロオキセピン、テトラヒドロオキセピン、パーヒドロオキセピン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、ジヒドロチアイン（ジヒドロチオピラン）、テトラヒドロチアイン（テトラヒドロチオピラン）、ジヒドロチエピン、テトラヒドロチエピン、パーヒドロチエピン、オキサゾリン（ジヒドロオキサゾール）、オキサゾリジン（テトラヒドロオキサゾール）、ジヒドロイソオキサゾール、テトラヒドロイソオキサゾール、オキサジアゾリン（ジヒドロオキサジアゾール）、オキサジアゾリジン（テトラヒドロオキサジアゾール）、チアゾリン（ジヒドロチアゾール）、チアゾリジン（テトラヒドロチアゾール）、ジヒドロイソチアゾール、テトラヒドロイソチアゾール、モルホリン、チオモルホリン、インドリン、イソインドリン、ジヒドロベンゾフラン、パーヒドロベンゾフラン、ジヒドロイソベンゾフラン、パーヒドロイソベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、パーヒドロベンゾチオフェン、ジヒドロイソベンゾチオフェン、パーヒドロイソベンゾチオフェン、ジヒドロインダゾール、パーヒドロインダゾール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パーヒドロキノリン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、パーヒドロイソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パーヒドロフタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パーヒドロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、パーヒドロキノキサリン、ジヒドロキナゾリン、

テトラヒドロキナゾリン、パーヒドロキナゾリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パーヒドロシンノリン、ジヒドロベンゾオキサゾール、パーヒドロベンゾオキサゾール、ジヒドロベンゾチアゾール、パーヒドロベンゾチアゾール、ジヒドロベンゾイミダゾール、パーヒドロベンゾイミダゾール、ジオキソラン、ジオキサン、ジオキサジン、ジオキサインダン、クロマン、イソクロマン環等が挙げられる。

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物において、



で表わされる環は、飽和、一部飽和、もしくは不飽和の５員の炭素環または複素環を表わす。この環中のＸおよびＹは、Ｘが炭素原子およびＹが窒素原子、Ｘが窒素原子およびＹが炭素原子、またはＸおよびＹのいずれも炭素原子のいずれの組合せであっても良い。

具体的には、(i) Ｘが炭素原子、Ｙが窒素原子であり、ＵおよびＺが炭素原子または窒素原子、およびWが炭素原子である組合せ、

(ii) Ｘが窒素原子、Ｙが炭素原子であり、ＵおよびＺが炭素原子または窒素原子、およびWが炭素原子である組合せ、

(iii) ＸおよびＹが炭素原子であり、ＵおよびWが炭素原子または窒素原子であり、Ｚが炭素原子である組合せ、

(iv) ＸおよびＹが炭素原子であり、Ｕが窒素原子およびＺが酸素原子または硫黄原子であるか、Ｕが酸素原子または硫黄原子およびＺが窒素原子であり、Wが炭素原子である組合せ、または

(v) ＸおよびＹが炭素原子であり、ＺおよびWが窒素原子であり、ＵがＣ＝ＯまたはＣ＝Ｓである組合せが好ましい。

より好ましくは、

(i-1) X、UおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子である組合せ、

(i-2) X、ZおよびWが炭素原子、YおよびUが窒素原子である組合せ、

(i-3) X、Z、UおよびWが炭素原子、Yが窒素原子である組合せ、

(ii-1) X、ZおよびUが窒素原子、YおよびWが炭素原子である組合せ、

(ii-2) XおよびZが窒素原子、Y、UおよびWが炭素原子である組合せ、

(ii-3) XおよびUが窒素原子、Y、ZおよびWが炭素原子である組合せ、

(ii-4) Xが窒素原子、Y、Z、UおよびWが炭素原子である組合せ、

(iii-1) X、YおよびZが炭素原子、UおよびWが窒素原子である組合せ、

(iii-2) X、Y、ZおよびUが炭素原子、Wが窒素原子である組合せ、

(iv-1) X、YおよびWが炭素原子、Zが酸素原子、Uが窒素原子である組合せ、

(iv-1) X、YおよびWが炭素原子、Zが硫黄原子、Uが窒素原子である組合せ、

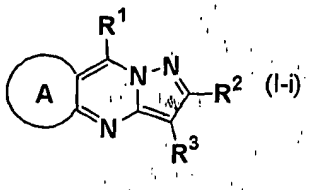
(iv-2) X、YおよびWが炭素原子、Zが窒素原子、Uが酸素原子である組合せ、

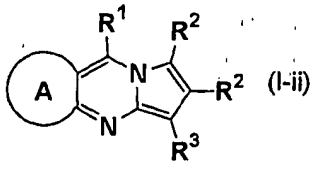
(iv-2) X、YおよびWが炭素原子、Zが窒素原子、Uが硫黄原子である組合せ、

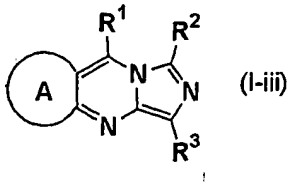
(v-1) XおよびYが炭素原子であり、ZおよびWが窒素原子であり、UがC＝Oである組合せ、

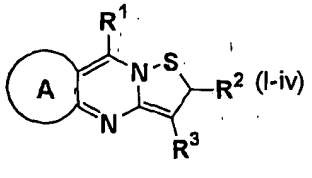
(v-2) XおよびYが炭素原子であり、ZおよびWが窒素原子であり、UがC＝Sである組合せである。

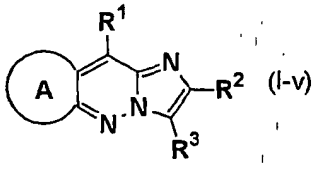
一般式（I）で示される本発明化合物において、より具体的な化合物としては以下の一般式（I－i）～一般式（I－xxvi）で示されるものが挙げられる。

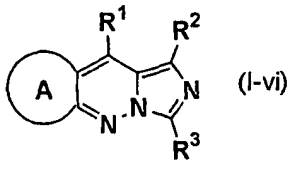

(I-i)

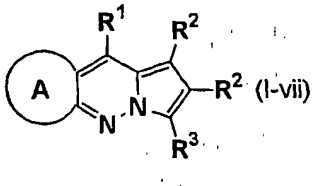

(I-ii)

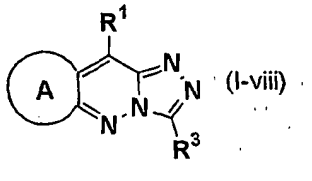

(I-iii)

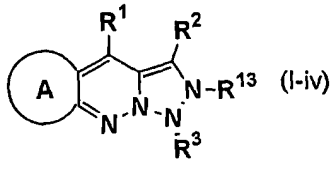

(I-iv)

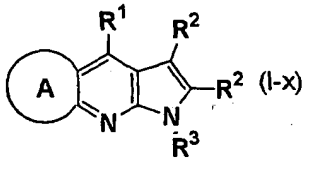

(I-v)

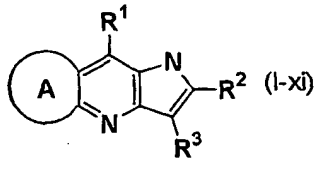

(I-vi)

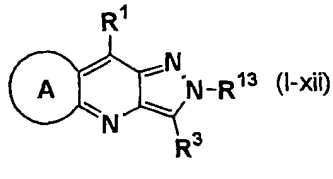

(I-vii)

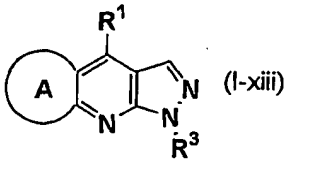

(I-viii)

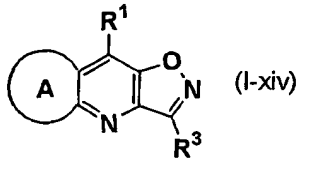

(I-iv)

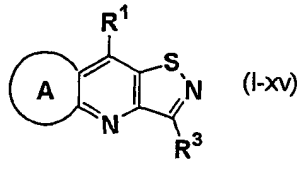

(I-x)

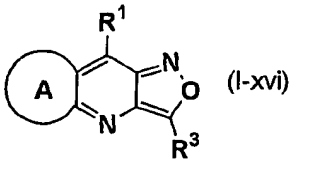

(I-xi)

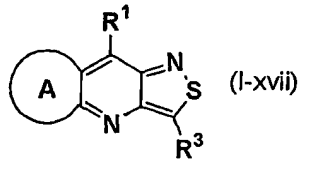

(I-xii)

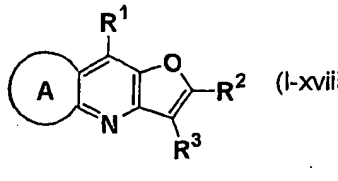

(I-xiii)

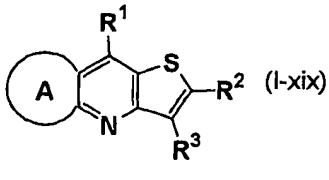

(I-xiv)

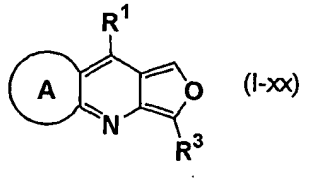

(I-xv)

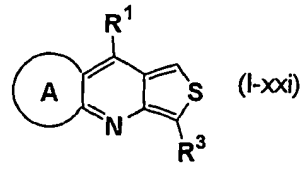

(I-xvi)

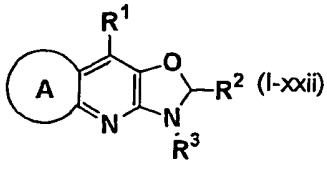

(I-xvii)

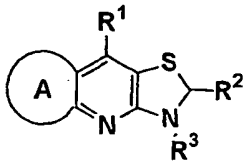

(I-xviii)

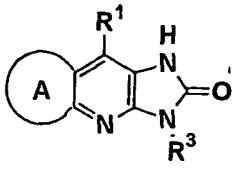

(I-xix)

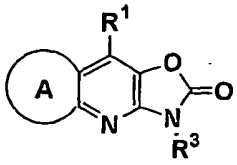

(I-xx)

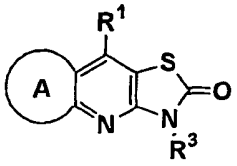

(I-xxi)


(I-xxii)

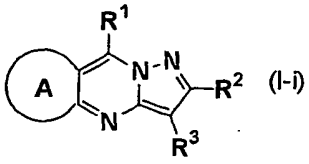

(I-xxiii)

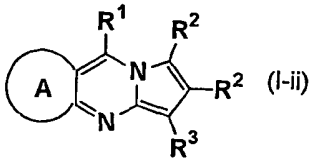

(I-xxiv)

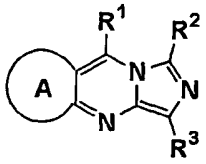

(I-xxv)

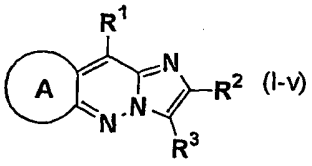

(I-xxvi)

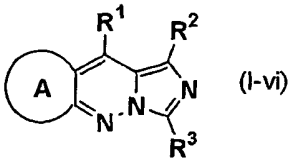
一般式（Ｉ－ｉ）～一般式（Ｉ－xxvi）で示される本発明化合物中、好ましい化合物としては以下の化合物が挙げられる。

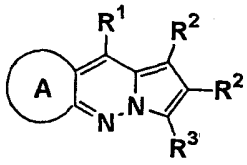

(I-i)

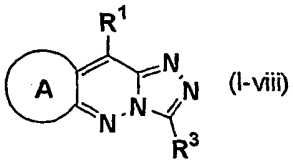

(I-ii)

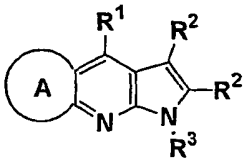

(I-iii)

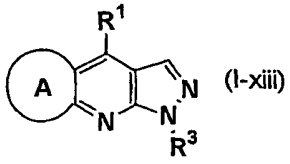

(I-v)

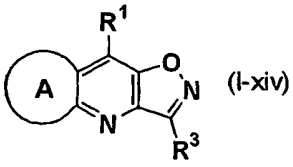

(I-vi)

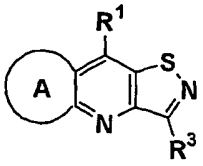

(I-vii)

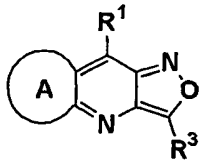

(I-viii)

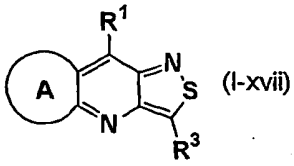

(I-x)

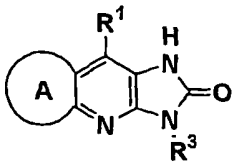

(I-xiii)


(I-xiv)


(I-xv)


(I-xvi)


(I-xvii)

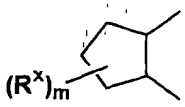

(I-xxiv)

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物において、

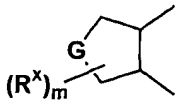


が表わすＣ４～６炭素環または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環としては、Ｃ４～６の炭素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したもの、または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環アリール、またはその一部もしくは全部が飽和したものが挙げられる。

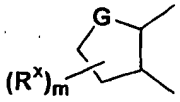
好ましいＡ環としては、例えば、以下に示す環が挙げられる。



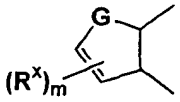
(A-1)



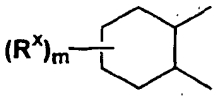
(A-2)



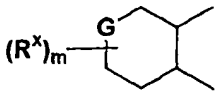
(A-3)



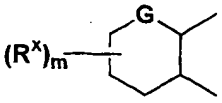
(A-4)



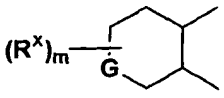
(A-5)



(A-6)



(A-7)



(A-8)

（式中、ＧはＯ、ＳまたはＮＨを表わし、R^XはＣ１～４アルキル、Ｃ１～４アルコキシ、ハロゲン原子、またはCF_3を表わし、ｍは０～３を表わす。）

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物において、好ましいR^1としては、

(i) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～８アルキル、

(ii) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルケニル、

(iii) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルキニル、

(iv)NR^4R^5、

(v)ＯＲ[6]、

(vi)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または

(vii)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環が挙げられる。

上記の好ましいＲ[1]基中のＮＲ[4]Ｒ[5]中、好ましいＲ[4]およびＲ[5]の組合せとしては、

(a)Ｒ[4]が(i)水素原子であり、Ｒ[5]が(ii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、(v)１～５個のＲ[18]で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(vi)１～５個のＲ[18]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環であるか、または

(b)Ｒ[4]が(ii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、または(v-1)Ｃ３～６の単環の飽和炭素環であり、Ｒ[5]が(ii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、

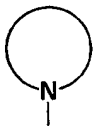
(iii)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、

(iv)１～５個のＲ[17]で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、

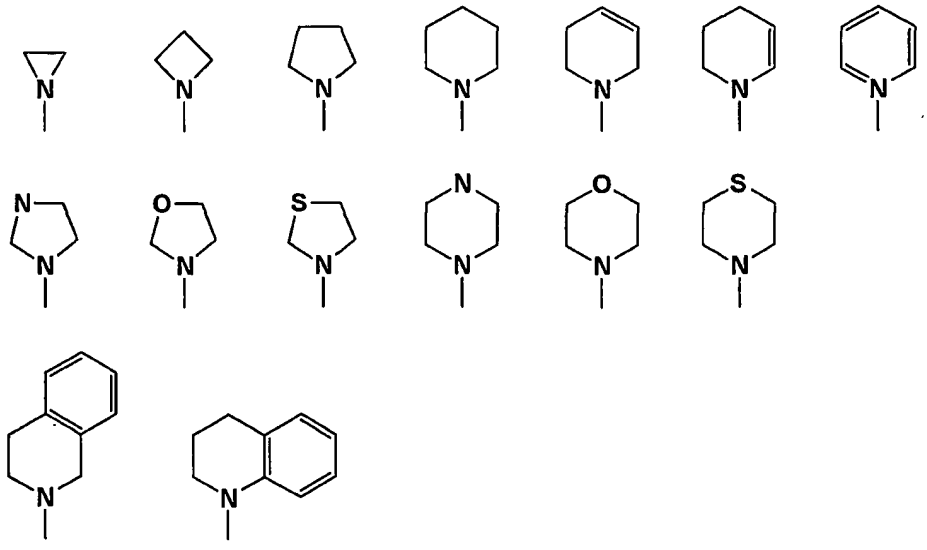
(v) １～５個のＲ[18]で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～５個のＲ[18]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環である組合せが挙げられる。

上記の好ましいＲ[1]基中の１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環において、該複素環はその環中の窒素原子を介して結合するものが好ましい。すなわち、１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の式



で示される基（この基は、窒素原子を必ず１個含有し、さらに窒素原子、酸素原子または硫黄原子を１個含有していても良い３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わす。）が挙げられる。具体的には、１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の下記の複素環が挙げられる。



本発明の具体的な化合物としては、後述の実施例で示す化合物、およびそれらの非毒性塩が挙げられる。

本発明においては、特に指示しない限り異性体はこれをすべて包含する。例えば、アルキル基、アルコキシ基、アルケニル基およびアルキニル基には直鎖のものおよび分岐鎖のものが含まれる。さらに二重結合、環、縮合環における異性体（E、Z、シス、トランス体）、不斉炭素の存在等による異性体（R、S体、α、β体、エナンチオマー、ジアステレオマー）、旋光性を有する光学異性体（D、L、d、l体、＋、－体）、クロマトグラフィー分離による極性体（高極性体、低極性体）、平衡化合物、これらの任意の割合の化合物、ラセミ混合物はすべて本発明に含まれる。

[塩]

一般式（I）で示される本発明化合物は、公知の方法で相当する薬学的に許容される塩に変換される。薬学的に許容される塩とは、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、アミン塩、酸付加物塩等が挙げられる。

塩は毒性のない、水溶性のものが好ましい。適当な非毒性塩としては、アルカリ金属（カリウム、ナトリウム等）の塩、アルカリ土類金属（カルシウム、マグネシウム等）の塩、アンモニウム塩、薬学的に許容される有機アミン（テトラメチルアンモニウム、トリエチルアミン、メチルアミン、ジメチルアミン、シクロペンチルアミン、ベンジルアミン、フェネチルアミン、ピペリジン、モノエタノールアミン、ジエタノールアミン、トリス（ヒドロキシメチル）アミノメタン、リジン、アルギニン、Ｎ－メチル－Ｄ－グルカミン等）の塩が挙げられる。好ましくは、アルカリ金属の塩である。

酸付加物塩は毒性のない、水溶性のものが好ましい。適当な酸付加物塩としては、塩酸塩、臭化水素塩、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩のような無機酸塩、または酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、乳酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、フマ

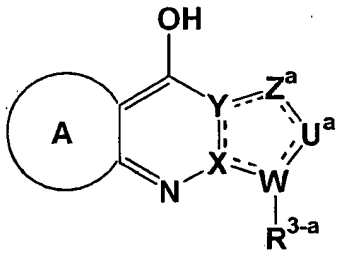
ル酸塩、マレイン酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、グルクロン酸塩、グルコン酸塩のような有機酸塩が挙げられる。

また、一般式（Ｉ）で示される本発明化合物およびその塩は、公知の方法により水和物に変換することもできる。

［本発明化合物の製造方法］

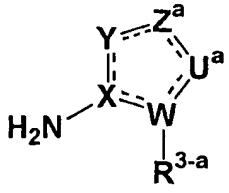
本発明化合物は、例えば以下の方法で製造することができる。

（Ａ）一般式（Ｉ）中、R^1がＯＨであり、かつR^2およびR^3中にＯＨ、シアノ、＝Ｎ－ＯR^{11}またはそれらを含有する基を表わさない化合物、すなわち一般式（Ｉ－Ａ）



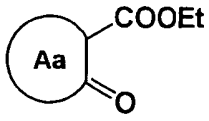
(I-A)

（式中、Z^a、U^aおよびR^{3-a}はそれぞれ、Ｚ、ＵおよびR^3と同じ意味を表わす。ただしそれらの基中にＯＨ、シアノ、＝Ｎ－ＯR^{11}またはそれらを含有する基を表わさない。その他の記号は前記を同じ意味を表わす。）で示される化合物は、一般式（Ⅱ－１）



(II-1)

（式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物と、一般式（Ⅲ－１）



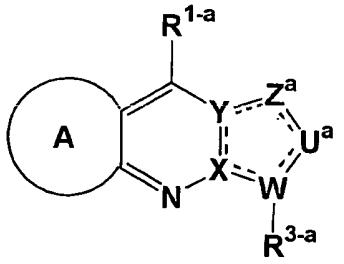
(III-1)

（式中、Ａａ環は飽和または一部飽和のＣ４～６炭素環または４～６員複素環を表わし、Ｅｔはエチル基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を反応させるか、あるいは引き続いて酸化反応に付すことによって製造することができる。

上記一般式（II）と一般式（III）で示される化合物の反応は公知であり、例えば、有機溶媒（酢酸等）中で、室温～還流温度で行なわれる。

酸化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ジフェニルエーテル等）中、金属触媒（パラジウム炭素、パラジウム、水酸化パラジウム、酢酸パラジウム、パラジウム黒等）を用いて、０℃～２５０℃で行なわれる。

（Ｂ）一般式（Ｉ）中、R^1はＯＨを表わさず、かつシアノ、＝Ｎ－ＯＲ^{6}またはそれらを含有する基、およびＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環を表わさず、R^2およびR^3はＯＨ、シアノ、＝Ｎ－ＯＲ^{11}またはそれらを含有する基を表わさない化合物、つまり一般式（Ｉ－Ｂ）

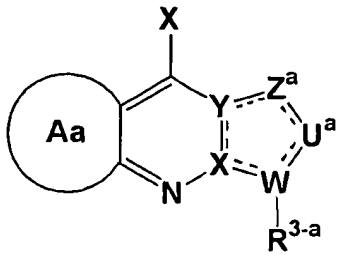


(I-B)

（式中、R^{1-a}はR^1と同じ意味を表わす。ただしＯＨを表わさず、かつシアノ、＝Ｎ－ＯＲ^{6}またはそれらを含有する基、およびＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または

１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環は表わさない。その他の記号は前記を同じ意味を表わす。）

で示される化合物は、一般式（IV）



(IV)

（式中、Ｘはハロゲン原子を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）

で示される化合物と、一般式（Ｖ－１）

$$H-R^{1-ab} \qquad (V\text{-}1)$$

（式中、R^{1-ab}はR^{1}と同じ意味を表わす。ただしＯＨを表わさず、かつシアノ、＝Ｎ－ＯＲ^{6}またはそれらを含有する基、およびＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環は表わさない。）

で示される化合物とを反応させるか、あるいは引き続いて酸化反応に付すか、または一般式（Ｖ－２）

$$R^{1-ac} \qquad (V\text{-}2)$$

（式中、R^{1-ac}はＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環を表わす。）で示される化合物とを反応させるか、あるいは引き続いて酸化反応に付すことによって製造すること

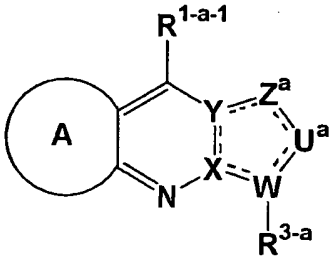
ができる。

上記一般式（IV）と一般式（Ｖ－１）で示される化合物の反応は公知であり、例えば、有機溶媒（イソプロピルアルコール、トルエン、エタノール、テトラヒドロフラン等）中あるいは無溶媒で、塩基（水素化ナトリウム、ナトリウムエトキシド等）の存在下または非存在下、０～２００℃で行なわれる。

上記一般式（IV）と一般式（Ｖ－２）で示される化合物の反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ジメトキシエタン、ジメチルホルムアミド等）中、触媒（酢酸パラジウム等）存在下、ホスフィン化合物（トリフェニルホスフィン等）を用いて、２０℃～還流温度で行なわれる。

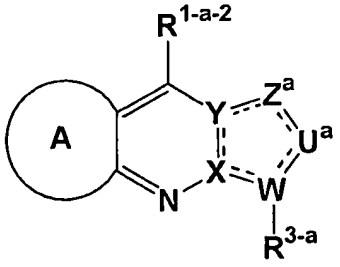
酸化反応は、前記と同様の方法で行なわれる。

また、一般式（Ｉ－Ｂ）で示される化合物中、R^{1-a}が１～２個のOR^6または$CONR^4R^5$で置換されているＣ１～４アルキルである化合物、つまり一般式（Ｉ－Ｂ－１）



(I-B-1)

（式中、R^{1-a-1}は、１～２個のOR^6または$CONR^4R^5$で置換されているＣ１～４アルキルを表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、一般式（Ｉ－Ｂ－２）



(I-B-2)

（式中、R^{1-a-2}は、１～２個のＣＯＯＲ^{6}で置換されているＣ１～４アルキルを表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を還元反応に付すか、もしくは還元反応に付した後、一般式（VI）

$$X-R^{6-a-2} \qquad (VI)$$

（式中、R^{6-a-2}は、(i)Ｃ１～１０アルキル、(ii)Ｃ２～１０アルケニル、(iii)Ｃ２～１０アルキニル、(iv)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する 3～１５員の単環もしくは二環式複素環、または(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）で示される化合物と反応させるか、あるいは一般式（VII）

$$HNR^{9}R^{10} \qquad (VII)$$

（式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物と反応させることにより製造することもできる。

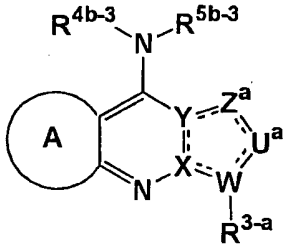
還元反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ジエチルエーテル、塩化メチ

レン、トルエン等）中、還元剤（ジイソプロピルアルミニウムヒドリド等）を用いて、－７８～５０℃で行なわれる。

一般式（Ｉ－Ｂ－２）で示される化合物の還元反応後の一般式（VI）で示される化合物との反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ジメチルホルムアミド等）中、塩基（水素化ナトリウム等）を用いて、０～５０℃で行なわれる。

一般式（Ｉ－Ｂ－２）で示される化合物の還元反応後の一般式（VII）で示される化合物との反応は公知であり、例えば、有機溶媒（メタノール、エタノール、イソプロパノール等）中、０～１００℃で行なわれる。

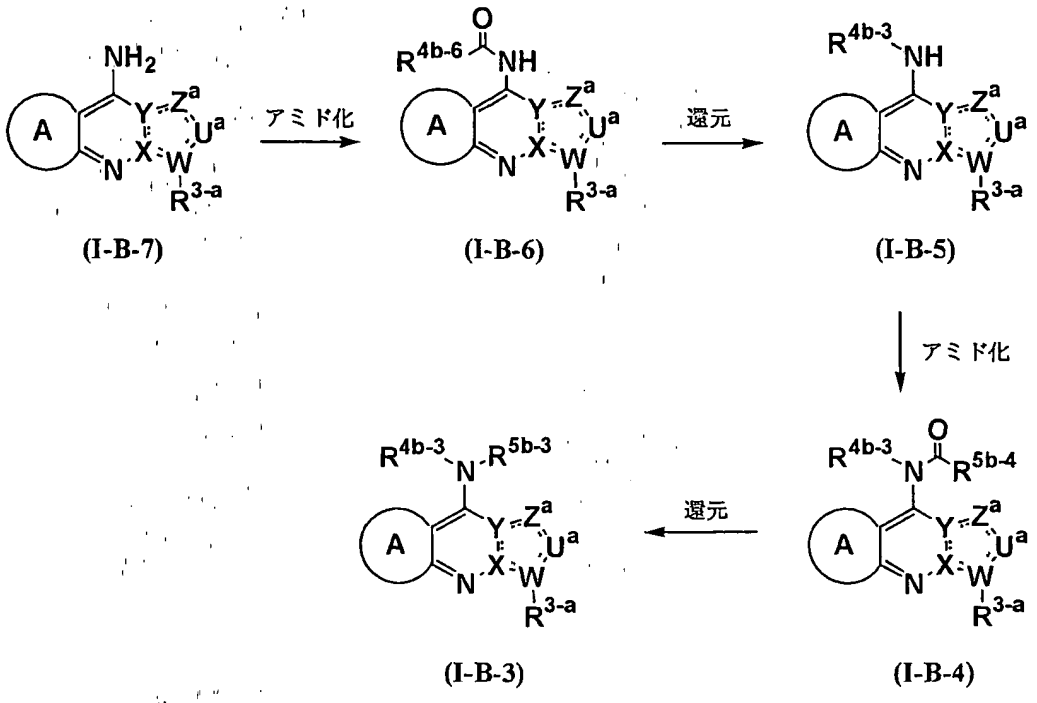
また、一般式（Ｉ－Ｂ）中、R^1がNR^4R^5であり、R^4およびR^5がそれぞれ独立して、１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキルであり、かつR^2およびR^3中にＯＨ、シアノ、＝Ｎ－ＯR^{11}またはそれらを含有する基を表わさない化合物、すなわち一般式（Ｉ－Ｂ－３）



(I-B-3)

（式中、R^{4b-3}およびR^{5b-3}はそれぞれ独立して、１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキルであり、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、以下の反応工程式（１）に示す方法によっても製造することができる。

反応工程式(1)

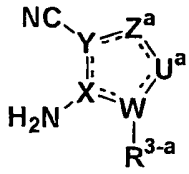


反応工程式（1）中、R^{4b-6}は１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１４アルキルを表わし、R^{5b-4}は１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１４アルキルを表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。

アミド化は公知であり、例えば、カルボン酸を有機溶媒（クロロホルム、塩化メチレン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等）中または無溶媒で、酸ハライド（オキザリルクロライド、チオニルクロライド等）と－２０℃～還流温度で反応させ、得られた酸ハライドを三級アミン（ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン等）の存在下、有機溶媒（クロロホルム、塩化メチレン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等）中、アミンと０～４０℃で反応させることにより行なわれる。この反応は、不活性ガス（アルゴン、窒素等）雰囲気下、無水条件で行なうことが望ましい。

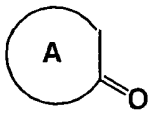
還元反応は公知であり、例えば、有機溶媒（テトラヒドロフラン等）中、還元剤（ボランジメチルスルフィド錯体、水素化リチウムアルミニウム等）を用いて、0℃～還流温度で行なわれる。

一般式（Ⅰ－Ｂ－７）は、一般式（Ⅱ－２）



(II-2)

（式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物と、一般式（Ⅲ－２）

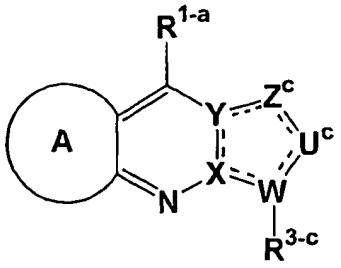


(III-2)

（式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を反応させるか、あるいは引き続いて酸化反応に付すことによって製造することができる。

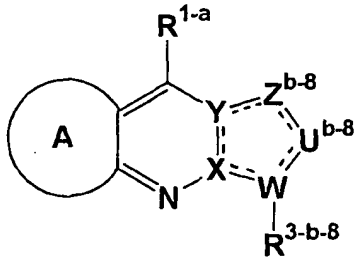
上記一般式（Ⅱ－２）と一般式（Ⅲ－２）で示される化合物の反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ベンゼン、トルエン等）中、酸（ｐ－トルエンスルホン酸、またはその水和物等）を用いて、室温～還流温度で行なわれた後、有機溶媒（テトラヒドロフラン等）中、塩基（リチウムジイソプロピルアミド等）を用いて、－１０～５０℃で行なわれる。

（Ｃ）一般式（Ｉ）中、R^2およびR^3が表わす基中、少なくとも１個がＯＨまたはそれを含有する基を表わす化合物、つまり一般式（Ｉ－Ｃ）



(I-C)

（式中、Z^c、U^cおよびR^{3-c}はそれぞれ、Z、UおよびR³と同じ意味を表わすが、ただしZ^c、U^cおよびR^{3-c}が表わす基中、少なくとも１個はＯＨまたはそれを含有する基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、一般式（Ｉ－Ｂ）で示される化合物中、R²およびR³が表わす基のうち少なくとも１個がメトキシ基またはそれを含有する基である化合物、すなわち一般式（Ｉ－Ｂ－８）



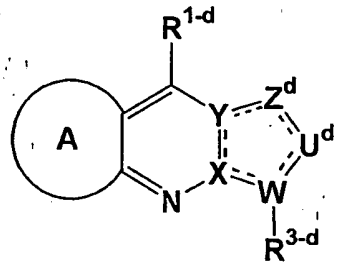
(I-B-8)

（式中、Z^{b-8}、U^{b-8}およびR^{3-b-8}はそれぞれ、Z、UおよびR³と同じ意味を表わすが、ただしZ^{b-8}、U^{b-8}およびR^{3-b-8}が表わす基中、少なくとも１個はメトキシ基またはそれを含有する基を有し、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を、脱メチル化反応に付すことにより製造することができる。

脱メチル化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（塩化メチレン、酢酸エチル、クロロホルム等）中、ルイス酸（三臭化ホウ素等）を用いて、－８０℃～８０℃で行なわれる。

（D）一般式（Ｉ）中、R¹、R²およびR³が表わす基中、少なくとも１個が＝Ｎ－ＯR⁶または＝Ｎ－ＯR¹¹を含有する基を表わす化合物、つまり一般式

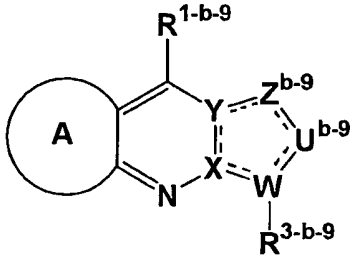
（Ｉ－Ｄ）



(I-D)

（式中、R^{1-d}、Z^d、U^dおよびR^{3-d}はそれぞれ、R^1、Ｚ、ＵおよびR^3と同じ意味を表わすが、ただしR^{1-d}、Z^d、U^dおよびR^{3-d}が表わす基中、少なくとも１個は＝Ｎ－ＯＲ^{6}または＝Ｎ－ＯＲ^{11}を含有する基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、

（１）一般式（Ｉ－Ｂ）で示される化合物中、R^1、R^2およびR^3が表わす基のうち少なくとも１個が－ＣＨ（Ｏ－Ｃ１～４アルキル）$_2$含有する基である化合物、すなわち一般式（Ｉ－Ｂ－９）

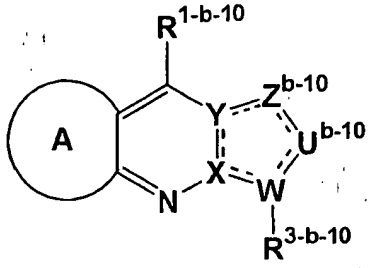


(I-B-9)

（式中、R^{1-b-9}、Z^{b-9}、U^{b-9}およびR^{3-b-9}は、それぞれR^1、Ｚ、ＵおよびR^3と同じ意味を表わす。ただしR^{1-b-9}、Z^{b-9}、U^{b-9}およびR^{3-b-9}が表わす基中、少なくとも１個は－ＣＨ（Ｏ－Ｃ１～４アルキル）$_2$を含有する基を表わす。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を脱アセタール反応に付し、引き続いてオキシム化反応に付すか、または

（２）一般式（Ｉ－Ｂ）で示される化合物中、R^{1-a}がＯＨを含有する基である化合物か、もしくは一般式（Ｉ－Ｃ）で示される化合物、すなわち一般式

（Ｉ－Ｂ－１０）



(I-B-10)

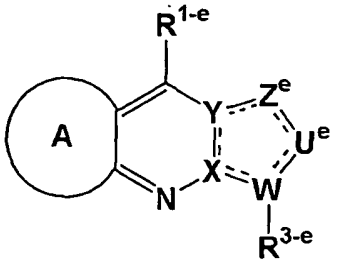
（式中、R^{1-b-10}、Z^{b-10}、U^{b-10}およびR^{3-b-10}は、それぞれR^1、Z、UおよびR^{3}と同じ意味を表わす。ただしR^{1-b-10}がＯＨを表わすか、もしくはZ^{b-10}、U^{b-10}およびR^{3-b-10}が表わす基中、少なくとも１個はＯＨを含有する基を表わす。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を酸化反応に付し、引き続いてオキシム化反応に付すことによって製造することができる。

脱アセタール化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（酢酸、ジオキサン等）中、酸（塩酸、硫酸等）を用いて、０～１００℃で行なわれる。

酸化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（塩化メチレン等）中、または無溶媒で、塩基（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等）存在下、ジメチルスルホキシドおよび三酸化硫黄ピリジン錯体、ジシクロヘキシルカルボジイミド、またはオキザリルクロリド等を用いて、０～５０℃で行なわれる。

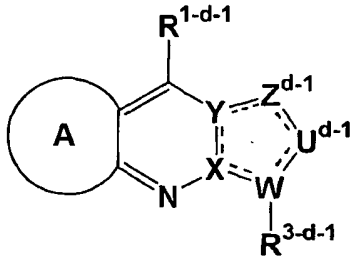
オキシム化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（ピリジン等）中、H_2N-O-R^6、またはH_2N-O-R^{11}用いて、０～５０℃で行なわれる。

（Ｅ）一般式（Ｉ）中、R^1、R^2およびR^3が表わす基中、少なくとも１個はシアノまたはそれを含有する基を含有する基を表わす化合物、つまり一般式（Ｉ－Ｅ）



(I-E)

（式中、R^{1-e}、Z^e、U^eおよびR^{3-e}は、それぞれR^1、Z、UおよびR^3と同じ意味を表わすが、ただしR^{1-e}、Z^e、U^eおよびR^{3-e}が表わす基中、少なくとも１個はシアノまたはそれを含有する基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、一般式（Ｉ－Ｄ）で示される化合物中、R^1、R^2およびR^3が表わす基のうち少なくとも１個が＝Ｎ－ＯＨを含有する基を表わす化合物、つまり一般式（Ｉ－Ｄ－１）



(I-D-1)

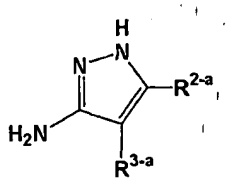
（式中、R^{1-d-1}、Z^{d-1}、U^{d-1}およびR^{3-d-1}は、それぞれR^1、Z、UおよびR^3と同じ意味を表わすが、ただしR^{1-d-1}、Z^{d-1}、U^{d-1}およびR^{3-d-1}が表わす基中、少なくとも１個は＝Ｎ－ＯＨを含有する基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物を脱水反応に付すことにより製造することができる。

脱水反応は公知であり、例えば、有機溶媒（塩化メチレン等）中、塩基（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等）存在下、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、またはクロロギ酸トリクロロメチル等を用いて、０～５０℃で行なわれる。

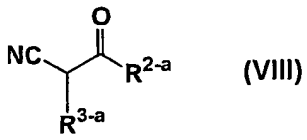
また、一般式（IV）で示される化合物は、一般式（Ｉ－Ａ）で示される化

合物をハロゲン化反応に付すことによって製造することができる。

その他の出発原料である一般式（II）、（III）、（V）、（VI）および（VII）で示される化合物は、それ自体公知であるか、または公知の方法に従って製造することができる。例えば、一般式（II）で示される化合物のうち、



（式中、R^{2-a}はR^2と同じ意味を表わすが、OH、シアノ、＝N－OR^{11}またはそれらを含有する基は表わさず、R^{3-a}は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物は、一般式（VIII）



(VIII)

（式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。）で示される化合物と、ヒドラジンを反応させることにより製造される。また、一般式（III）で示される化合物のうち、シクロペンタノン－２－カルボン酸エチルエステルは市販されている。また、一般式（VI）で示される化合物のうち、１－シアノ－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）プロパン－２－オンは、Bioorganic & Med. Chem., 8, 181-189 (2000)に記載されている。

また、本発明中における他の出発物質および各試薬は、それ自体公知であるかまたは公知の方法に従って製造することができる。

本明細書中の各反応において、反応生成物は通常の精製手段、例えば、常圧下または減圧下における蒸留、シリカゲルまたはケイ酸マグネシウムを用いた高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、あるいはカラムクロマトグラフィーまたは洗浄、再結晶等の方法により精製することがで

きる。精製は各反応ごとに行なってもよいし、いくつかの反応終了後に行なってもよい。

図面の簡単な説明

図１は、本発明化合物を１、３、１０および３０ｍｇ／ｋｇ投与したラットのオープンアームにおける滞在時間を示すグラフである。

図２は、本発明化合物を１、３、１０および３０ｍｇ／ｋｇ投与したラットがオープンアームに入る回数を示すグラフである。

［本発明化合物の薬理活性］

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物がＣＲＦ受容体拮抗活性を有することは、以下の実験で確認された。

（１）バインディングアッセイ

［膜調製］

ヒトＣＲＦ受容体１型強制発現細胞株（親株はＣＨＯ－Ｋ１細胞）をコンフレントになるまで培養した後、スクレイパーを用いて回収した。回収した細胞をＰＢＳで２回洗浄した後、氷冷したバインディングアッセイ緩衝液（Tris-HＣｌ（５０mM、ｐH7.0）、ＥＤＴＡ（２mM、ｐH8.0）、$MgCl_2$（１０mM））で懸濁した。懸濁した細胞をダウンス型のホモジナイザーを用いて破砕した後、10000ｇで遠心し、膜画分を回収した。回収した膜画分を少量のバインディングアッセイ緩衝液で再懸濁した後、濃度が１ｍｇ／ｍｌになるようバインディングアッセイ緩衝液で希釈した。以上を膜画分としてバインディングアッセイに用いた。

［バインディングアッセイ］

^{125}Ｉ－ＣＲＦを0.5ｎMになるようにバインディングアッセイ緩衝液で希釈し、シリコナイズした1.5ｍｌチューブに５０μＬ加えた。次に適当倍希釈

した被検薬、ＤＭＳＯ（バインディング用）、または１００μＭのＣＲＦ（非特異的用）を１μＬチューブに加えた。最後に５０μＬの膜画分を加え、反応を開始させた（^{125}Ｉ－ＣＲＦの最終濃度は0.25ｎＭ）。チューブを室温で２時間インキュベートした。反応終了後、膜画分を回収するため15000ｒｐｍで遠心した後、上清を捨て、氷冷したＰＢＳ／0.01%Triton Ｘ－１００で２回洗浄した。膜結合カウントは、ガンマカウンターを用いて測定した。

特異的結合は、測定カウントから非特異的結合のカウントを引いて求めた。

その結果、本発明化合物は強い受容体結合活性（IC_{50}値＜１μＭ）を有することがわかった。

（２）高架式十字迷路による抗不安活性

床面より５０ｃｍの高さに、同じ長さ（５０×１０ｃｍ）の２本のオープンアームと、同じ長さ（５０×１０ｃｍ）の２本のクローズアーム（４０ｃｍの壁を設置）を互いに直角に交差するように設置し、高架式十字迷路装置とした。照明は両方のオープンアームにおける照度を一定にするように設置した。

評価の３０分前に種々濃度の被検薬（５ｍｌ／ｋｇ）を経口投与したＳＤ系雄性ラットを装置の中心部に静置し、オープンアームにおける滞在時間（秒）および各アームに入る回数を５分間計測した。実験者は評価時間中、定位置にて計測した。

結果を図１～２に示す。

図１および２より、本発明の実施例２（７８）の化合物は、投与量３および１０ｍｇ／ｋｇにおいて、有意な滞在時間延長および進入回数の増加が見られる。つまり、有意な抗不安作用が認められた。

［毒性］

本発明化合物の毒性は十分に低いものであり、医薬品として使用するために十分安全であることが確認された。

産業上の利用可能性

[医薬品への適用]

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物は、ＣＲＦ受容体拮抗作用を有するため、ＣＲＦの分泌異常によって引き起こされる疾患、例えばストレス関連疾患を含む多様な障害または疾病に有効である。例えば、うつ病、単一エピソードうつ病、再発性うつ病、分娩後うつ病、小児虐待誘発性うつ病、不安症、不安障害（パニック障害、特定の恐怖症、高所恐怖症、社会恐怖、強迫性障害）、感情障害、双極性障害、心的外傷後ストレス（ＰＴＳＤ）、消化性潰瘍、下痢、便秘、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患（潰瘍性大腸炎、クローン病）、ストレスに伴う胃腸機能障害、神経性嘔吐、摂食異常（神経性食欲不振、過食症）、肥満症、ストレス誘発性睡眠障害、繊維筋痛性睡眠障害、ストレス誘導性免疫抑制、ストレス誘発性頭痛、ストレス誘発性熱、ストレス誘発性疼痛、手術襲撃ストレス、慢性関節リウマチ、変形性骨関節症、骨粗鬆症、乾癬、甲状腺機能障害症候群、ブドウ膜炎、喘息、不適切な抗下痢ホルモンに基づく症状、疼痛、炎症、アレルギー性疾患、頭部損傷、脊髄損傷、虚血性ニューロン損傷、分泌毒性ニューロン損傷、クッシング病、発作、痙攣、筋痙攣、てんかん虚血性疾患、パーキンソン病、ハンティングトン病、尿失禁、アルツハイマー病、アルツハイマー型老人性痴呆、多梗塞性痴呆症、筋萎縮性側索硬化症、低血糖症、心血管または心臓関連疾患（高血圧、頻脈、うっ血性心不全）、薬物またはアルコールの禁断症状等の疾患の予防および／または治療剤として有用である。

一般式（Ｉ）で示される本発明化合物、その非毒性の塩、酸付加塩、またはその水和物を上記の目的で用いるには、通常、全身的または局所的に、経口または非経口の形で投与される。

投与量は、年齢、体重、症状、治療効果、投与方法、処理時間等により異

なるが、通常、成人一人あたり、１回につき、１ｍｇから1000ｍｇの範囲で、１日１回から数回経口投与されるか、または成人一人あたり、１回につき、0.1ｍｇから１００ｍｇの範囲で、１日１回から数回非経口投与（好ましくは、静脈内投与）されるか、または１日１時間から２４時間の範囲で静脈内に持続投与される。

もちろん前記したように、投与量は種々の条件によって変動するので、上記投与量より少ない量で十分な場合もあるし、また範囲を越えて必要な場合もある。

本発明化合物を投与する際には、経口投与のための内服用固形剤、内服用液剤および、非経口投与のための注射剤、外用剤、坐剤等として用いられる。

経口投与のための内服用固形剤には、錠剤、丸剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤等が含まれる。カプセル剤には、ハードカプセルおよびソフトカプセルが含まれる。

このような内服用固形剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質はそのままか、または賦形剤（ラクトース、マンニトール、グルコース、微結晶セルロース、デンプン等）、結合剤（ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム等）、崩壊剤（繊維素グリコール酸カルシウム等）、滑沢剤（ステアリン酸マグネシウム等）、安定剤、溶解補助剤（グルタミン酸、アスパラギン酸等）等と混合され、常法に従って製剤化して用いられる。また、必要によりコーティング剤（白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート等）で被覆していてもよいし、また２以上の層で被覆していてもよい。さらにゼラチンのような吸収されうる物質のカプセルも包含される。

経口投与のための内服用液剤は、薬剤的に許容される水剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤、エリキシル剤等を含む。このような液剤においては、ひとつま

たはそれ以上の活性物質が、一般的に用いられる希釈剤（精製水、エタノールまたはそれらの混液等）に溶解、懸濁または乳化される。さらにこの液剤は、湿潤剤、懸濁化剤、乳化剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、保存剤、緩衝剤等を含有していてもよい。

非経口投与のための注射剤としては、溶液、懸濁液、乳濁液および用時溶剤に溶解または懸濁して用いる固形の注射剤を包含する。注射剤は、ひとつまたはそれ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。溶剤として、例えば注射用蒸留水、生理食塩水、植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、エタノールのようなアルコール類等およびそれらの組み合わせが用いられる。さらにこの注射剤は、安定剤、溶解補助剤（グルタミン酸、アスパラギン酸、ポリソルベート８０（登録商標）等）、懸濁化剤、乳化剤、無痛化剤、緩衝剤、保存剤等を含んでいてもよい。これらは最終工程において滅菌するか無菌操作法によって製造、調製される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造し、その使用前に無菌化または無菌の注射用蒸留水または他の溶剤に溶解して使用することもできる。

非経口投与のためのその他の製剤としては、ひとつまたはそれ以上の活性物質を含み、常法により処方される外用液剤、軟膏剤、塗布剤、吸入剤、スプレー剤、坐剤および膣内投与のためのペッサリー等が含まれる。

スプレー剤は、一般的に用いられる希釈剤以外に亜硫酸水素ナトリウムのような安定剤と等張性を与えるような緩衝剤、例えば塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウムあるいはクエン酸のような等張剤を含有していてもよい。スプレー剤の製造方法は、例えば米国特許第 2,868,691 号および同第 3,095,355 号に詳しく記載されている。

発明を実施するための最良の形態

以下、参考例および実施例によって本発明を詳述するが、本発明はこれら

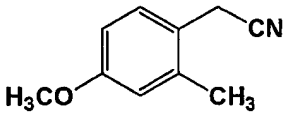
に限定されるものではない。

クロマトグラフィーによる分離の箇所およびＴＬＣに示されるカッコ内の溶媒は、使用した溶出溶媒または展開溶媒を示し、割合は体積比を表わす。

ＮＭＲの箇所に示されているカッコ内の溶媒は、測定に使用した溶媒を示している。

参考例１

２－メチル－４－メトキシフェニルアセトニトリル



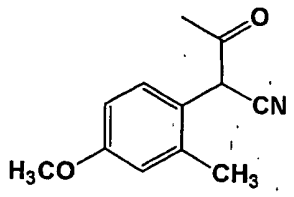
アルゴン気流下、１，２－ジメチル－４－メトキシベンゼン（13.6ｇ）の四塩化炭素（２００ｍｌ）溶液に、Ｎ－ブロモスクシイミド（17.8ｇ）および２，２'－アゾビスイソブチロニトリル（４９２ｍｇ）の混合物を加え、6.5 時間還流した。反応混合物を氷冷し、不溶物をセライトろ過し、四塩化炭素で洗浄した。ろ液を併せて濃縮した。残渣をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１００ｍｌ）に溶解し、シアン化ナトリウム（9.86ｇ）を加え、室温で一晩撹拌した。反応混合物を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：６→１：４）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（11.78ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝９：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.24 (d, J = 8.0Hz, 1H), 6.78-6.72 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.60 (s, 2H), 2.32 (s, 3H)。

参考例２

1－シアノ－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）プロパン－2－オン

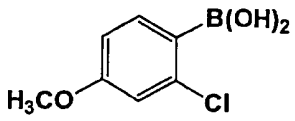


アルゴン気流下、参考例1で製造した化合物（11.7g）の酢酸エチル（60ml）溶液に、金属ナトリウム（2.3g）を数回に分けて加え、50℃で2時間撹拌した。反応溶液に酢酸エチル（40ml）を加え、2.5時間還流し、さらに室温で一晩撹拌した。析出物をろ取し、ジエチルエーテルで洗浄し、得られた結晶を水（300ml）に溶解した。2N塩酸でpH4とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（12.06g）を得た。

TLC：Rf 0.45（n－ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）。

参考例3

2－クロロ－4－メトキシボロン酸



3－クロロ－4－ブロモアニソール(2.14g)の無水テトラヒドロフラン(10ml）溶液を－78℃に冷却し、1.56Mのn－ブチルリチウム／ヘキサン（6.5ml）溶液を滴下し、30分間撹拌した。反応混合物に、ホウ酸トリイソプロピル（2.3ml）を滴下し、－78℃で2時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた固体を

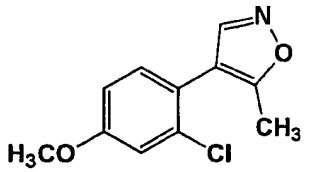
ｔ－ブチルメチルエーテル（４ｍｌ）で洗浄し、ろ過後、乾燥して、以下の物性値を有する標題化合物（６８１ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（塩化メチレン：メタノール＝１９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) ：δ 7.22 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.79 (s, 3H)。

参考例４

４－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５－メチルイソキサゾール



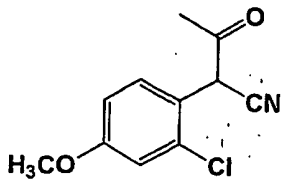
参考例３で製造した化合物（６４４ｍｇ）、４－ヨード－５－メチルイソキサゾール（６５８ｍｇ）、および炭酸水素ナトリウム（７９１ｍｇ）のジメトキシエタン（2.5ｍｌ）／水（2.5ｍｌ）懸濁液に、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム（３６ｍｇ）を加え、８０℃で１６時間撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、水および酢酸エチルを加え、不溶物をろ過して除去した。ろ液の有機層を分離し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１９：１→１５：１）で精製し、以下の物性値を有する標題化合物（６３７ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.44（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.29 (brs, 1H), 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.41 (brs, 3H)。

参考例５

1－シアノ－1－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）プロパン－2－オン



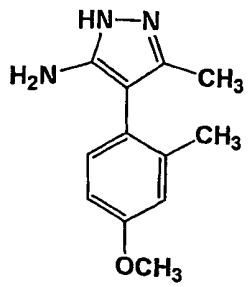
参考例4で製造した化合物（623mg）のメタノール（2.8ml）溶液に、1.5Mナトリウムメトキシド／メタノール溶液（2.8ml）を加え、室温で4時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、ヘキサン／t－ブチルメチルエーテル（10ml；1／1）で洗浄した。水層に4N塩酸（1ml）を加えて、pH5とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（497mg）を得た。

TLC：Rf 0.13（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.11 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)。

参考例6

5－アミノ－3－メチル－4－（2－メチル－4－メトキシフェニル）ピラゾール



参考例2で製造した化合物（8.63g）のトルエン（200ml）溶液に、酢

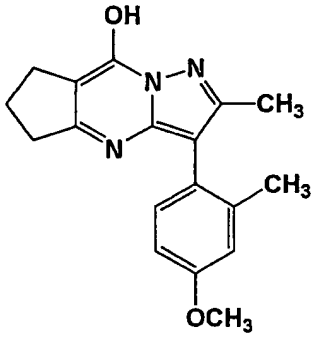
酸（8.0ｍｌ）およびヒドラジン・１水和物（4.5ｍｌ）を加えた。反応混合物を5.5時間還流し、さらに室温で一晩撹拌した。反応溶液を濃縮し、残渣に６Ｎ塩酸を加え、酢酸エチル／ｎ－ヘキサン（３０ｍｌ／３０ｍｌ）で抽出した。水層を濃アンモニア水で塩基性にし、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮して以下の物性値を有する標題化合物（8.38ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ7.08 (d, J = 8.0Hz, 1H), 6.84 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.0, 2.5Hz, 1H), 4.10 (br s, 3H), 3.83 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.07 (s, 3H)。

実施例１

８－ヒドロキシ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



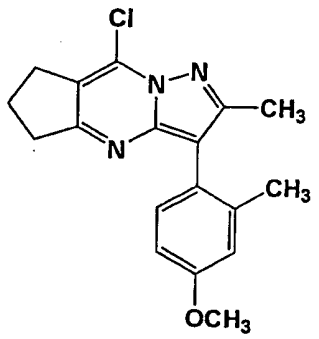
参考例６で製造した化合物（５００ｍｇ）の酢酸（３ｍｌ）溶液に、シクロペンタノン－２－カルボン酸エチルエステル（0.40ｍｌ）を加え、３時間還流した。反応溶液を室温に冷却後、ジエチルエーテル／ｎ－ヘキサン（１０ｍｌ；２：１）を加えた。析出した結晶をろ取し、ジエチルエーテル／ｎ－ヘキサン（１０ｍｌ；２：１）で洗浄し、乾燥して、以下の物性値を有する標題化合物（４８０ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 11.90 (br s, 1H), 7.10 (d, J = 8.0Hz, 1H), 6.93 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.0, 3.0Hz, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.81 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.66 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 2.03 (m, 2H)。

参考例７

８－クロロ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例１で製造した化合物（４００ｍｇ）のトルエン（４ｍｌ）懸濁液に、オキシ塩化リン（0.60ｍｌ）およびジエチルアニリン（0.25ｍｌ）を加え、１時間還流した。反応溶液を冷却後、冷却した炭酸水素ナトリウム水溶液に加え、１０分間撹拌し、過剰のオキシ塩化リンを分解した。反応溶液を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：３→１：２）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（４１１ｍｇ）を得た。

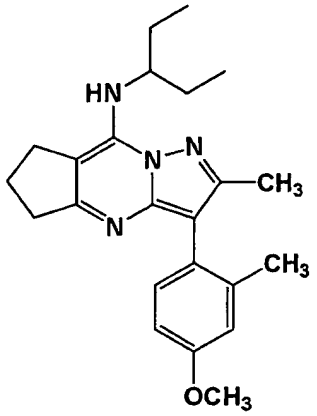
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.09-3.00 (m, 4H), 2.40 (s, 3H) , 2.23 (m, 2H),

2.15 (s, 3H)。

実施例２

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



参考例７で製造した化合物（１５０ｍｇ）、および３－ペンチルアミン（0.6ｍｌ）の混合物を１４０℃で１時間撹拌した。反応混合物を冷却後、シリカゲルのカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ｎ－ヘキサン＝１：３）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（１６９ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.5, 3.0Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.0Hz, 2H), 2.89 (t, J = 8.0Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.69 (m 4H), 1.02 (m, 6H)。

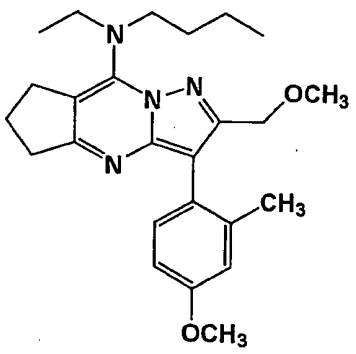
実施例２（１）～２（３６５）

１，２－ジメチル－４－メトキシベンゼンの代わりに、相当する化合物を

用いて、参考例１→参考例２→参考例６→実施例１（シクロペンタノン－２－カルボン酸エチルエステルの代わりに、相当する化合物を用いる。）→参考例７→実施例２（３－ペンチルアミンの代わりに、相当する化合物を用いる。）と同様の操作をするか、あるいは参考例5で製造した化合物またはこれに相当する化合物を用いて、参考例６→実施例１→参考例７→実施例２と同様の操作をするか、またそれらに続いて公知の塩にする操作を行うことによって、以下の化合物を得た。

実施例２（１）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－メトキシメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

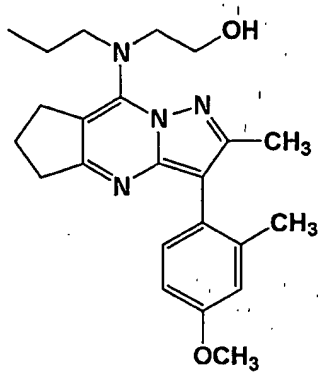


ＴＬＣ：Ｒｆ0.43（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.22 (d, J = 8.7Hz, 1 H), 6.84 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.77 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1 H), 4.49 (m, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2 H), 3.61 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 3.33 (s, 3 H), 2.97 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.19 (s, 3 H), 2.13 (m, 2 H), 1.55 (m, 2 H), 1.35 (m, 2 H), 1.17 (t, J = 7.2Hz, 3 H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

実施例２（２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

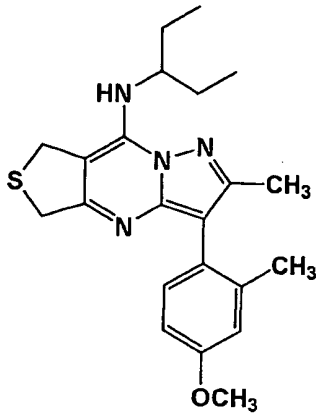


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ (300MHz, $CDCl_3$) ：δ 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 3.90 (t, J = 4.8Hz, 2 H), 3.83 (s, 3 H), 3.64 (m, 2 H), 3.43 (m, 2 H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.15 (m, 2 H), 1.58 (m, 2 H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

実施例２（３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－チエノ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

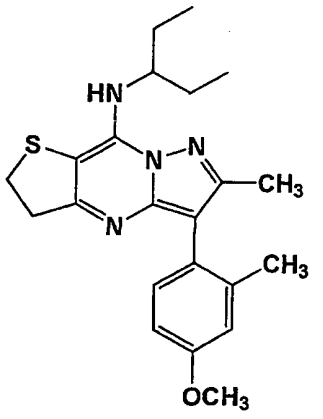


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 6.44 (d, J = 10.0Hz, 1H), 4.32 (br s, 2H), 4.14 (br s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.76 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.84-1.57 (m 4H), 1.03 (t, J = 7.0Hz, 6H)。

実施例２（４）

９－（３－ペンチルアミノ）－６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－２，３－ジヒドロ－チエノ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

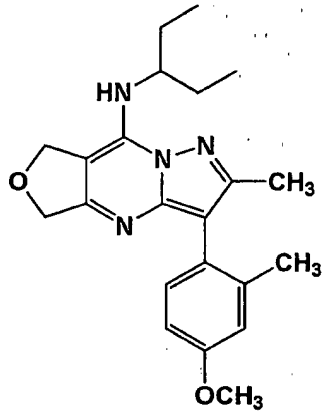


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.5, 3.0Hz, 1H), 6.17 (d, J = 10.0Hz, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.36-3.20 (m. 4H), 2.30 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.82-1.56 (m 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

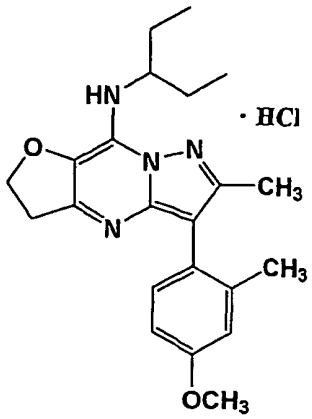


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 6.32 (d, J = 10.0Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.90 (br s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.24 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.84-1.56 (m 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（６）

９－（３－ペンチルアミノ）－６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－２，３－ジヒドロフロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

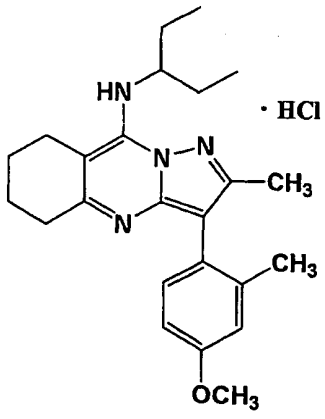


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (brs, 1H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.76 (t, J = 9.0Hz, 2H), 4.30 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (t, J = 9.0Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.90-1.70 (m, 4H), 1.04 (m, 6H)。

実施例２（７）

９－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，６，７，８－テトラヒドロ－ピラゾロ［３，２－ｂ］キナゾリン・塩酸塩

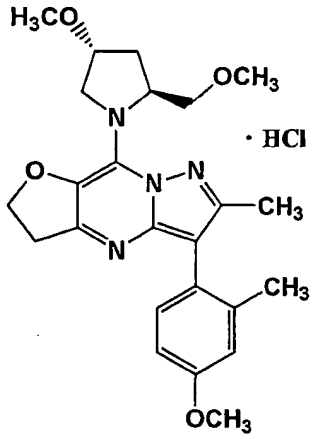


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 13.04 (br s, 1H), 7.91 (br s, 1H), 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.96 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 5.65 (br s, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.75 (m, 2H), 2.58 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.88-1.64(m, 8H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（８）

６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－９－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－２，３－ジヒドロ－フロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

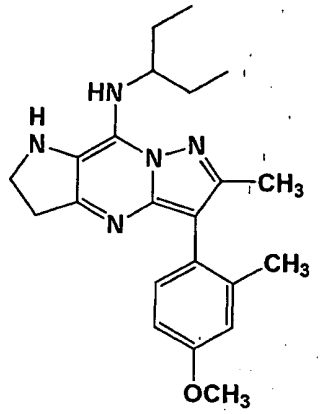


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.24（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.09 (d, J = 7.5Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 7.5, 2.4Hz, 1H), 5.07 (brs, 1H), 4.66 (dt, J = 9.0, 9.0Hz, 1H), 4.56 (dt, J = 9.0, 9.0Hz, 1H), 4.24 (dd, J = 12.6, 3.6Hz, 1H), 4.05 (brs, 1H), 3.85 (d, J = 12.6Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.42 (dd, J = 10.2, 3.9Hz, 1H), 3.33 (dd, J = 10.2, 5.1Hz, 1H), 3.22 (dd, J = 9.0, 9.0Hz, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 2.30-1.95 (m, 2H)。

実施例２（９）

9－（3－ペンチルアミノ）－6－メチル－5－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－2，3－ジヒドロ－ピロロ［3，2－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

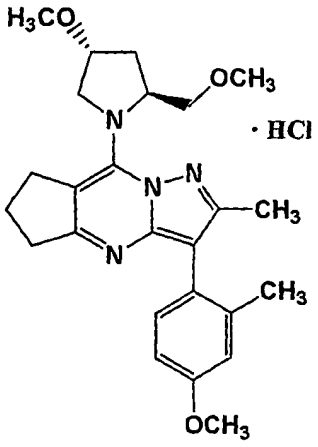


TLC：Rf 0.37（n－ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.86 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.58 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.06 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.52-1.82 (m, 4H), 1.01 (m, 6H)。

実施例2（10）

2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－8－［（2S，4R）－4－メトキシ－2－メトキシメチルピロリジン－1－イル］－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

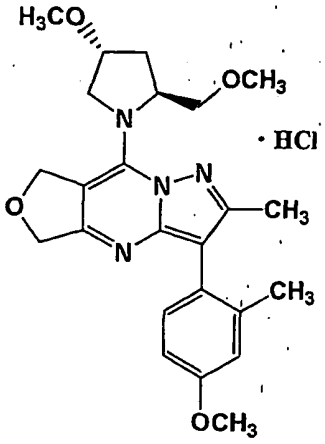


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 and 7.07 (d, J = 8.4Hz, two comformers, 1H), 6.89 and 6.87 (d, J = 2.7Hz, two comformers, 1H), 6.83 and 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, two comformers, 1H), 5.65 (brs, 1H), 4.32-4.10 (m, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.50-3.40 (m, 4H), 3.367 and 3.361 (s, two comformers, 3H), 3.29 and 3.28 (s, two comformers, 3H), 3.23-2.99 (m, 2H), 2.42 (m, 1H), 2.30-2.10 (m, 3H), 2.245 and 2.240 (s, two comformers, 3H), 2.22 and 2.14 (s, two comformers, 3H)。

実施例２（１１）

２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－８－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

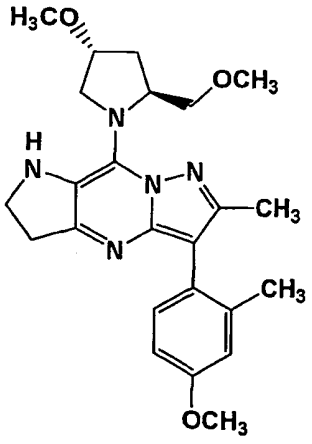


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

(300MHz, DMSO-d_6) 7.10 (brs, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.33 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.25 (brs, 1H), 5.15 (d, J = 10.8Hz, 1H), 4.85 (d, J = 14.4Hz, 1H), 4.75 (d, J = 14.4Hz, 1H), 4.10-3.85 (m, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.39 (dd, J = 9.9, 4.5Hz, 1H), 3.28 (dd, J = 9.9, 5.1Hz, 1H), 3.22 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 2.25 (m, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.15-2.00 (m, 4H)。

実施例２（１２）

６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－９－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－２，３－ジヒドロ－ピロロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

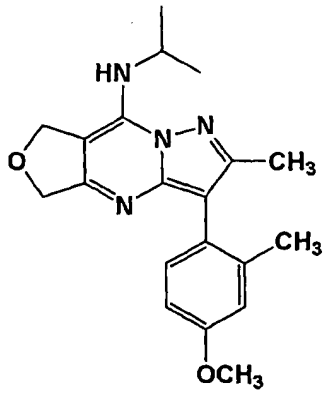


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（クロロホルム：メタノール＝２０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.71 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 4.06 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.60 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.54 (m, 1H), 3.48 (dd, J = 4.5, 9.6Hz, 1H), 3.39 (m, 1H), 3.34 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.09 (m, 2H), 2.24-2.40 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.01 (m, 1H)。

実施例２（１３）

８－イソプロピルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

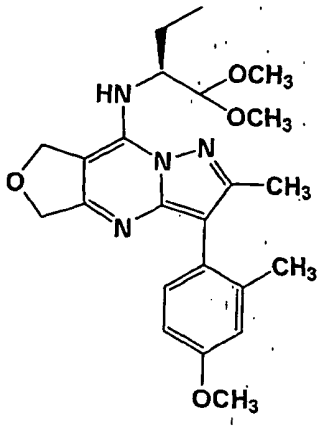


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.39 (d, J = 9.6Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.74 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例２（１４）

８－［（２Ｓ）－１，１－ジメトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

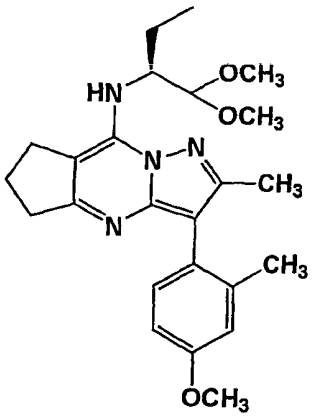


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.57 (brd, J = 11.1Hz, 1H), 5.36 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.26 (d, J = 9.9Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.33 (d, J = 3.9Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.39 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.88 (m, 1H), 1.68 (m, 1H), 1.04 (brs, 3H)。

実施例２（１５）

８－［（２Ｓ）－１，１－ジメトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

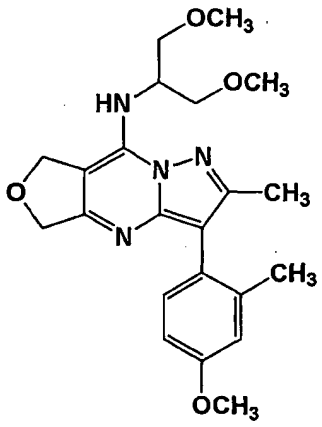


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.1, 3.0Hz, 1H), 6.47 (brd, J = 11.8Hz, 1H), 4.34 (brs, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.49 (s, 6H), 3.19-3.00 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.86 (m, 1H), 1.65 (m, 1H), 1.04 (brs, 3H)。

実施例２（１６）

８－（１，３－ジメトキシプロパン－２－イル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



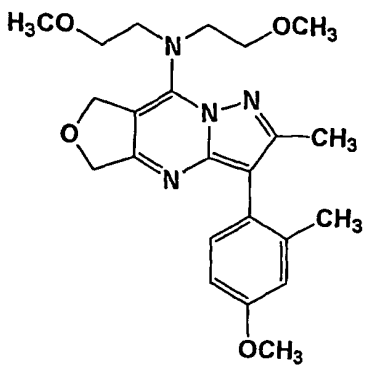
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (brd, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.75 (m, 1H), 3.62 (d, J = 4.8Hz, 4H), 3.42 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

実施例２（１７）

８－ビス（２－メトキシエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ

［1，5－a］ピリミジン

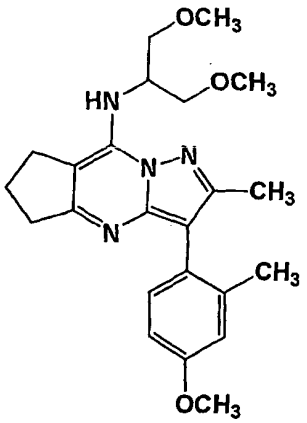


TLC：Rf 0.24（n－ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.22 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.88 (t, J = 6.0Hz, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.55 (t, J = 6.0Hz, 4H), 3.30 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

実施例2（18）

8－（1，3－ジメトキシプロパン－2－イル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン



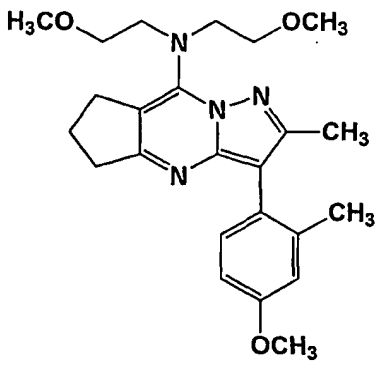
TLC：Rf 0.53（n－ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.01 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.72 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.64

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.60 (d, J = 9.9Hz, 1H), 4.14 (m, 1H), 3.69 (s, 3H), 3.50 (d, J = 5.4Hz, 4H), 3.30 (s, 6H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.76 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 2.01 (m, 2H)。

実施例２（１９）

８－ビス（２－メトキシエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

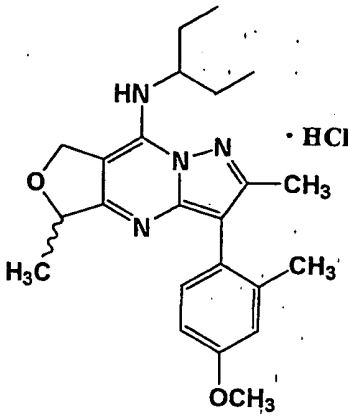


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.88 (t, J = 5.7Hz, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.52 (t, J = 5.7Hz, 4H), 3.30 (s, 6H), 3.00 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.14 (m, 2H)。

実施例２（２０）

（５ＲＳ）－８－（３－ペンチルアミノ）－２，５－ジメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

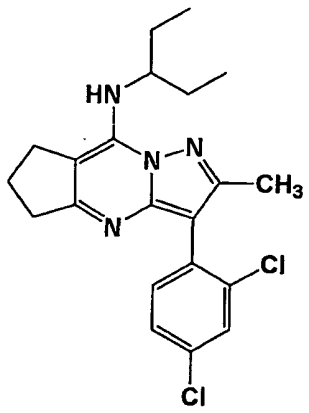


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.44（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ　8.71 (br s, 1H), 7.15 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 5.70 (br s, 1H), 5.25 (dd, J = 10.0, 2.0Hz, 1H), 5.17 (d, J = 10.0Hz, 1H), 5.11 (m, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.26 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.83-1.57 (m 4H), 1.41 (d, J = 5.5Hz, 3H), 0.93-0.83 (m, 6H)。

実施例２（２１）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，４－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

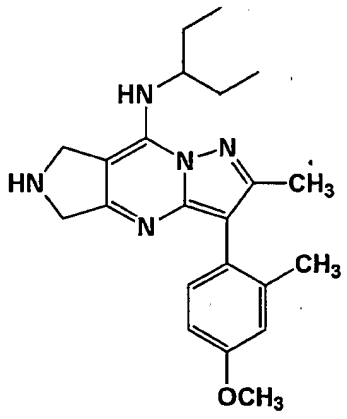


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.50（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.50 (d, J = 2.0Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.5Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 8.5, 2.0Hz, 1H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.81 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.82-1.55 (m 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－ピロロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

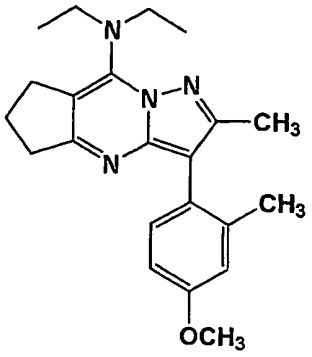


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（クロロホルム：メタノール＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1H, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 6.29 (d, J = 10.2Hz, 1H), 4.43 (s, 2H), 4.10 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.49 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.55-1.84 (m, 4H), 1.02 (m, 6H)。

実施例２（２３）

８－ジエチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

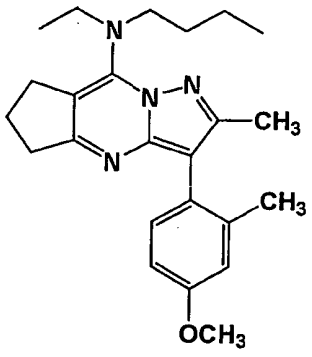


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.67（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.66 (q, J = 7.2Hz, 4H), 2.99 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２４）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２，４－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



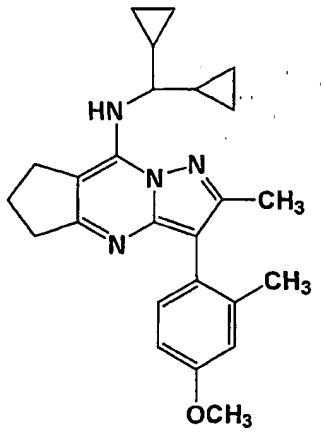
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.78（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.70-3.56 (m, 4H), 2.97 (t, J = 6.9Hz, 2H),

2.91 (t, J = 7.7Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.32 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２５）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

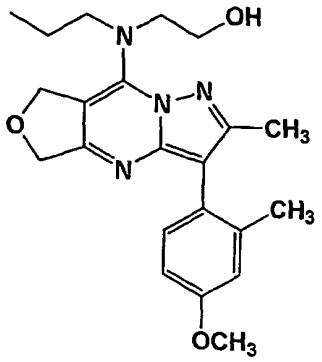


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.36 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.41 (m, 1H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.87 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.10 (m, 2H), 1.20-1.08 (m, 2H), 0.66-0.32 (m, 8H)。

実施例２（２６）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

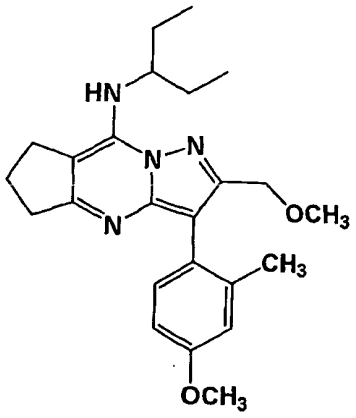


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）；

ＮＭＲ (300MHz, $CDCl_3$) ：δ 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 6.54 (brs, 1 H), 5.21 (s, 2 H), 4.89 (s, 2 H), 3.96 (brt, J = 4.8Hz, 2 H), 3.83 (s, 3 H), 3.80 (m, 2 H), 3.29 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.33 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 1.63 (m, 2 H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3 H)。

実施例２（２７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メトキシメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



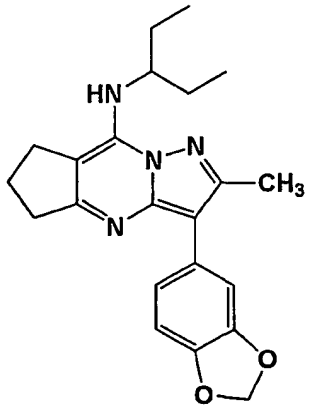
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.27（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.19 (d, J = 8.5Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.5Hz, 1H), 6.78

(dd, J = 8.5, 2.5Hz, 1H), 6.32 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.54-4.40 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.37 (s, 3H), 3.10 (t, J = 7.0Hz, 2H) , 2.91 (t, J = 8.0Hz, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.80-1.53 (m, 4H), 1.08-0.94 (m, 6H)。

実施例２（２８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（１，３－ジオキサインダン－５－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

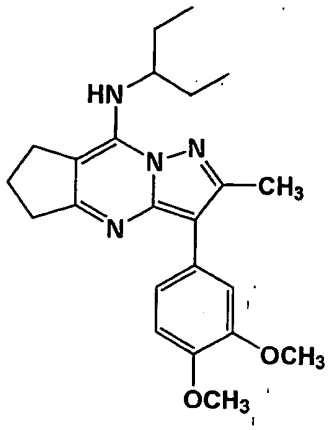


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.22 (d, J = 1.5Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 1.5, 8.1Hz, 1H), 6.89 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.20 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 5.96 (s, 2H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.51-1.80 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２９）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（３，４－ジメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

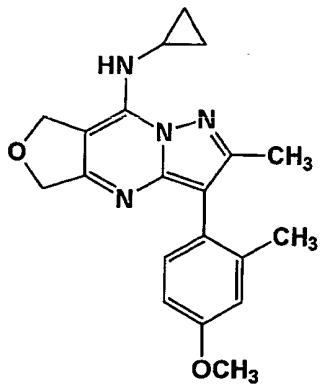


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.19 (dd, J = 2.1, 8.1Hz, 1H), 6.96 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.20 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 3.80 (m,1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.16 (m, 2H), 1.53-1.81 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３０）

８－シクロプロピルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



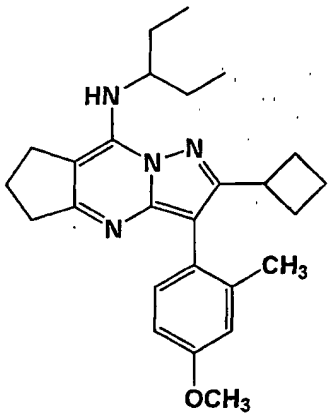
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：２）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79

(dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.62 (brs, 1H), 5.54 (brs, 2H), 4.91 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.89 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 0.98-0.84 (m, 4H)。

実施例２（３１）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－シクロブチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

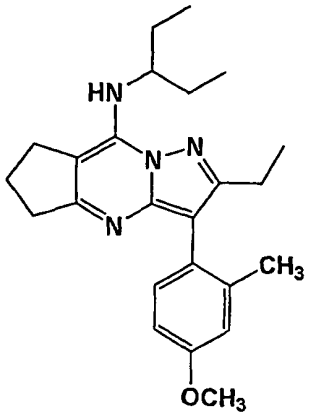


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.62（ベンゼン：酢酸エチル＝５：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.09 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.83 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.75 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.35 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.53 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.41 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 4H), 2.15 (s, 3H), 2.01-1.58 (m, 6H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.02 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

実施例２（３２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－エチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

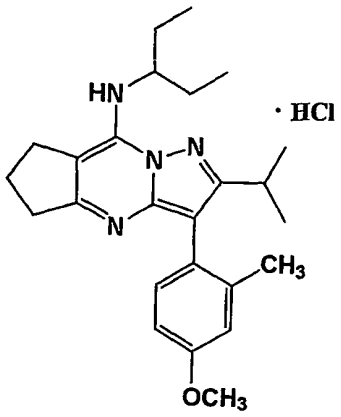


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.59（ベンゼン：酢酸エチル＝５：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.27 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.67 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.81-1.52 (m, 4H), 1.16 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

実施例２（３３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－イソプロピル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

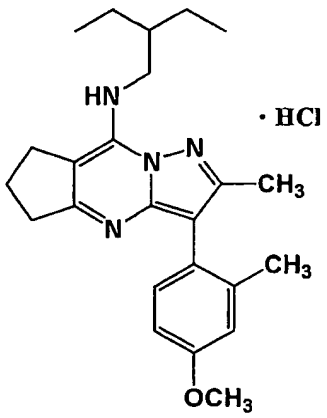


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.99 (m, 1H), 2.28 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.85 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.24 (d, J = 6.9Hz, 3H), 1.19 (d, J = 7.2Hz, 3H), 1.08 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３４）

８－（２－エチルブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

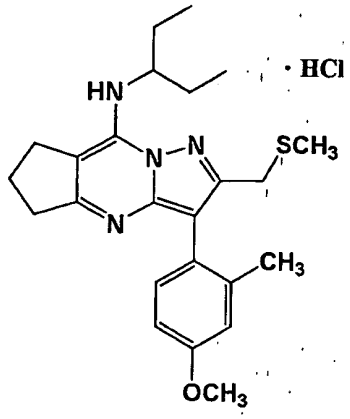


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.46 (m, 1H), 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.49 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.21 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.68 (m, 1H), 1.53 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチルチオメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

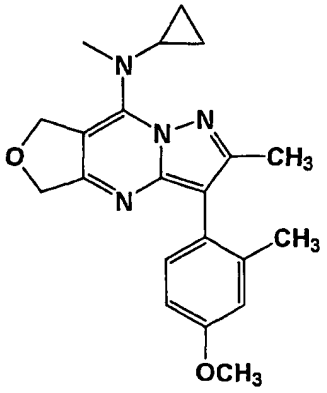


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.31（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.00 (brs, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.70 (d, J = 13.5Hz, 1H), 3.60 (d, J = 13.5Hz, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.14 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.95-1.65 (m, 4H), 1.07 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３６）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

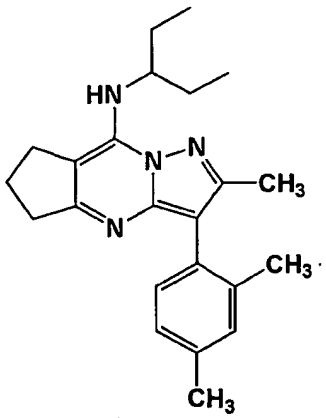


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.16（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.47 (brs, 2H), 4.90 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 2.80 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 0.84 (d, J = 6.0Hz, 4H)。

実施例２（３７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，４－ジメチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



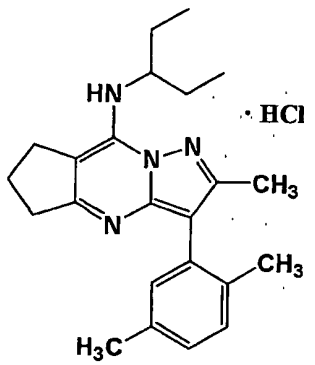
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.13 (d, J = 7.5Hz, 1H), 7.11 (br s, 1H), 7.03 (m, 1H), 6.21 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz,

2H), 2.34 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.56-1.82 (m, 4H), 1.02 (m, 6H)。

実施例２（３８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，５－ジメチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

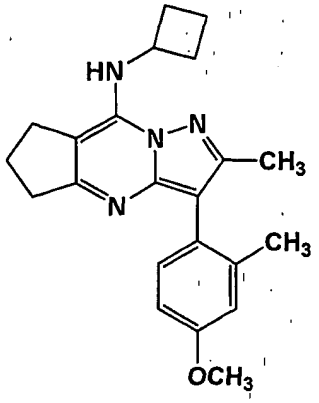


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (br d, J = 10.2Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.5Hz, 1H), 7.15 (br dd, J = 1.2, 7.5Hz, 1H), 7.01 (br s, 1H),3.99 (m, 1H), 3.49 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.14 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.64-1.94 (m, 4H), 1.07 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３９）

８－シクロブチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

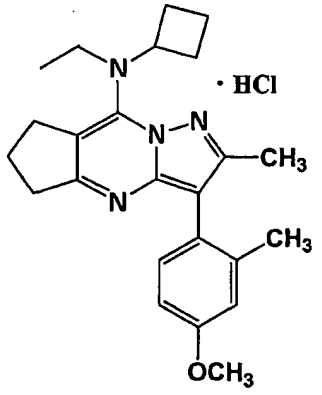


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.50 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 4.46 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.43 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.23-2.08 (m, 4H), 2.16 (s, 3H), 1.90-1.70 (m, 2H)。

実施例２（４０）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－シクロブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



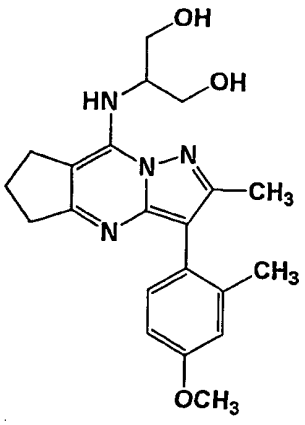
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

(dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.74 (m, 1H), 3.99 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.98 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.20-2.10 (m, 6H), 2.30 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.90-1.70 (m, 2H), 1.16 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（４１）

８－（プロパン－１，３－ジオール－２－イル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

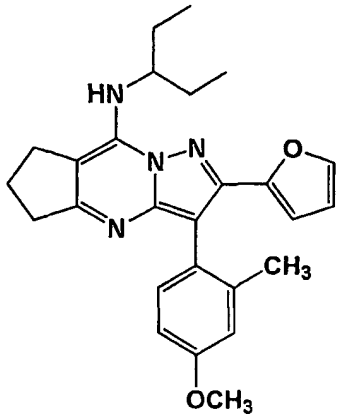


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.44（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.73 (d, J = 10.2Hz, 1H), 4.12 (m, 1H), 3.98-3.83 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.87 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.11 (m, 2H)。

実施例２（４２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－（２－フリル）－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

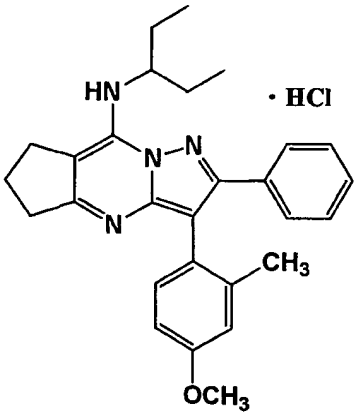


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.47 (m, 1H), 7.21 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.38-6.30 (m, 2H), 6.05 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.70 (m, 4H), 1.04 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（４３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－フェニル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

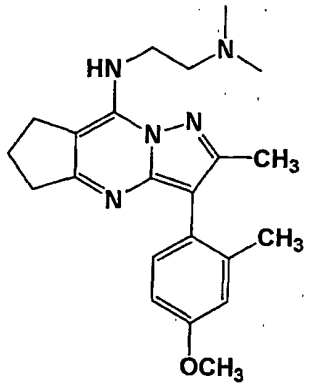


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.59-7.54 (m, 2H), 7.45-7.19 (m, 5H), 6.88-6.82 (m, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.55 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.17 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (m, 2H), 2.05 (s, 3H), 1.97-1.55 (m, 4H), 1.10 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（４４）

８－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

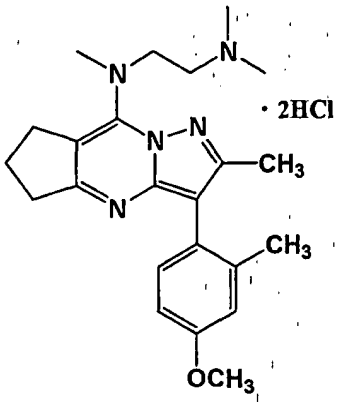


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（塩化メチレン：メタノール＝１９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.71 (t, J = 5.7Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.75 (dt, J = 5.7, 6.3Hz, 2H), 3.19 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.63 (t, J = 6.3Hz, 2H), 2.33 (s, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.12 (m, 2H)。

実施例２（４５）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

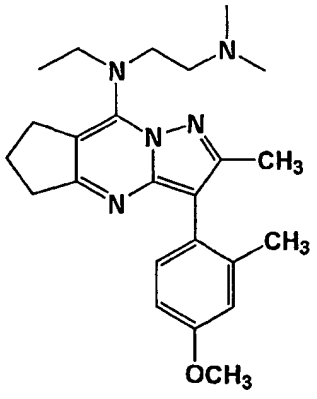


TLC：Rf 0.46（塩化メチレン：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, pyridine-d_5 0.5ml + $CDCl_3$ 0.1ml)：δ 7.42 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.21 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.85 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.00 (s, 6H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.80 (t, J = 7.5 HZ, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.90 (m, 2H)。

実施例２（４６）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



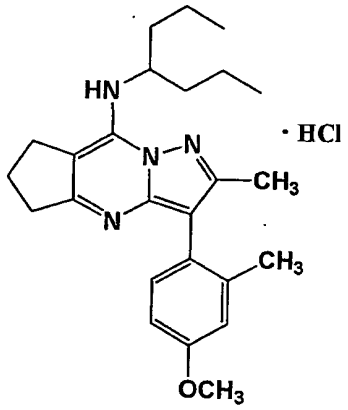
TLC：Rf 0.46（塩化メチレン：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.80 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.64 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.56 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.25 (s, 6H), 2.17 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（４７）

８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



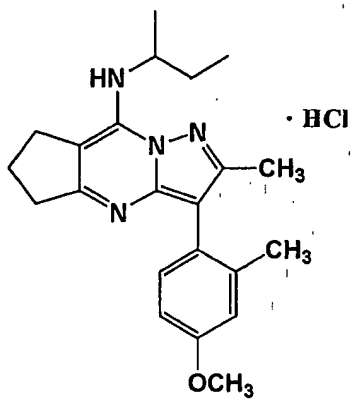
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 (brd, J = 9.6Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.12 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.49 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32-2.20 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.82-1.60 (m, 4H), 1.60-1.36 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（４８）

８－（２－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，

５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

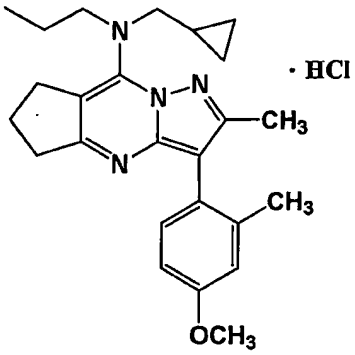


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.4Hz, two comformers, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.18 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.16 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40-2.20 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.19 and 2.18 (s, two comformers, 3H), 1.80 (m, 2H), 1.48 and 1.47 (d, J = 6.6Hz, two comformers, 3H), 1.09 and 1.08 (t, J = 7.2Hz, two comformers, 3H)。

実施例２（４９）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

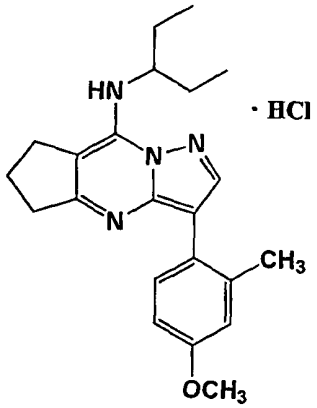


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.13 (m, 1H), 6.88 (br s, 1H), 6.82 (m, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.83 (br s, 3H), 3.77 (br s, 2H), 3.37 (m, 2H), 3.06 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.73 (m, 2H), 1.12 (m, 1H), 0.96 (m, 3H), 0.62 (m, 2H), 0.26 (br s, 2H)。

実施例２（５０）

８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



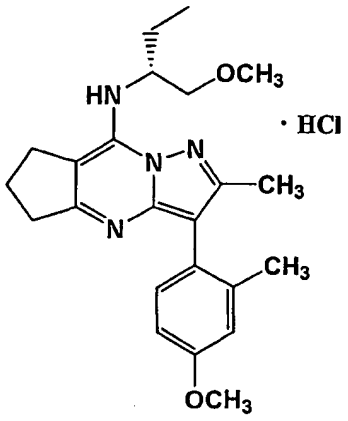
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 9.25 (m, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.23 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.15 (m, 2H), 3.02 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.18 (m, 2H), 1.60-1.88 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（５１）

８－［（２Ｒ）－１－メトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３

－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

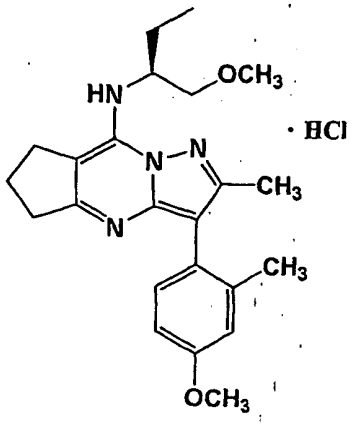


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.21（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.63 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.65-3.53 (m, 2H), 3.45 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.43 and 3.41 (s, two comformers, 3H), 3.26-3.01 (m, 2H), 2.30-2.20 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.96-1.58 (m, 2H), 1.08 and 1.07 (t, J = 7.5Hz, two comformers, 3H)。

実施例２（５２）

８－［（２Ｓ）－１－メトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

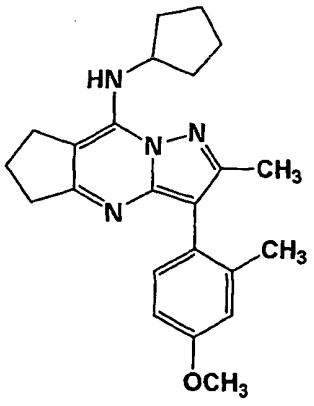


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.21（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ　7.59 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.66-3.53 (m, 2H), 3.48 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.44 and 3.42 (s, two comformers, 3H), 3.26-3.02 (m, 2H), 2.30-2.20 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.98-1.69 (m, 2H), 1.09 and 1.08 (t, J = 7.5Hz, two comformers, 3H)。

実施例２（５３）

８－シクロペンチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

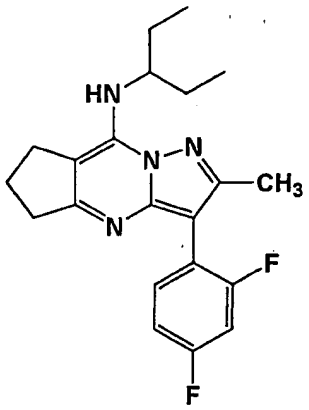


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.84 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.34 (brd, J = 9.0Hz, 1H), 4.38 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.15 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.18-2.00 (m, 4H), 1.95-1.65 (m, 6H)。

実施例２（５４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，４－ジフルオロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

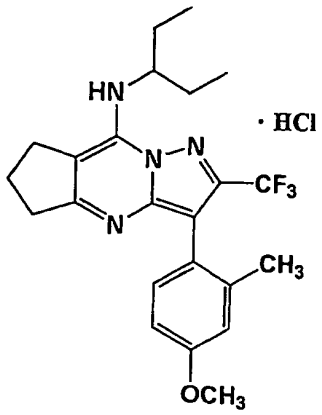


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.50 (ddd, J = 6.6, 8.4, 8.4Hz, 1H), 6.86-6.99 (m, 2H), 6.23 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J =8.1Hz, 2H), 2.39 (d, J = 1.5Hz, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.53-1.81 (m, 4H), 1.01 (t, J =7.2Hz, 6H)。

実施例２（５５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－トリフルオロメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

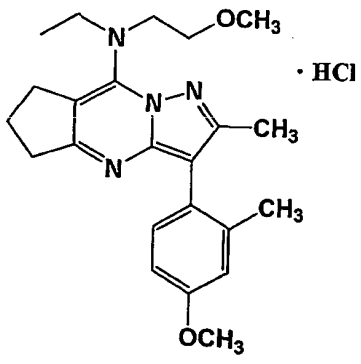


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (br d, J = 10.2Hz, 1H), 7.13 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.04 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (m, 2H), 3.20 (m, 2H), 2.33 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1. 70-2.22 (m, 4H), 1.08 (m, 6H)。

実施例２（５６）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



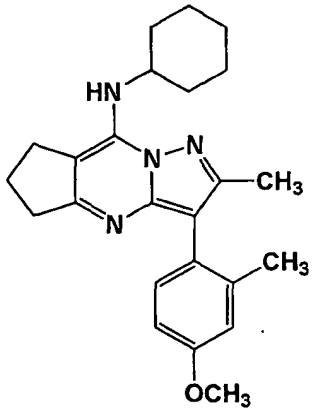
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.34-4.17 (m, 2H), 3.91 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.68 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.47 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.06 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.30-2.20 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.38 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（５７）

８－シクロヘキシルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

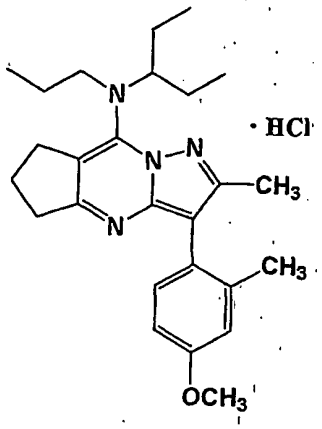


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.84 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.34 (brd, J = 9.6Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.10 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.18-2.00 (m, 4H), 1.90-1.80 (m, 2H), 1.75-1.60 (m, 1H), 1.50-1.20 (m, 5H)。

実施例２（５８）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－ペンチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

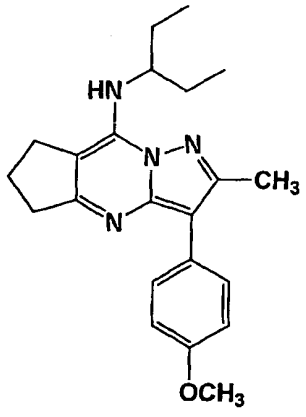


TLC：Rf 0.43（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.38 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.30-2.15 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.00-1.70 (m, 4H), 1.42 (m, 2H), 0.98 (t, J = 7.5Hz, 6H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例2（59）

8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

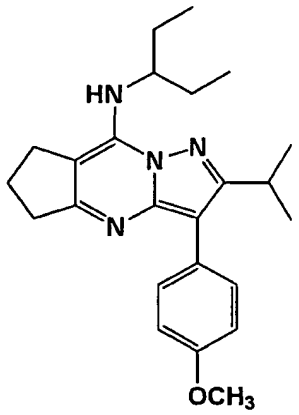


TLC：Rf 0.57（n－ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.60 (d, J = 9.0Hz, 2H), 6.99 (d, J = 9.0Hz, 2H), 6.10 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.53-1.82 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（６０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－イソプロピル－３－（４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

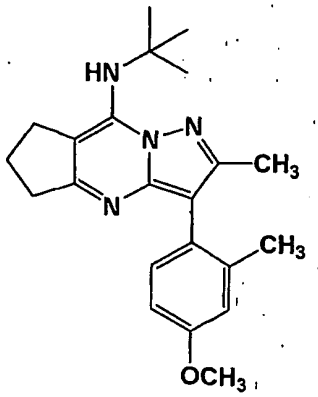


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.48 (d, J = 8.7Hz, 2H), 6.97 (d, J = 8.7Hz, 2H), 6.29 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.32 (sept, J = 6.9Hz, 1H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.13 (m, 2H) , 1.63-1.83 (m, 4H), 1.33 (d, J = 6.9Hz, 6H), 1.01 (t, J = 7.5 HZ, 6H)。

実施例２（６１）

８－ｔ－ブチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

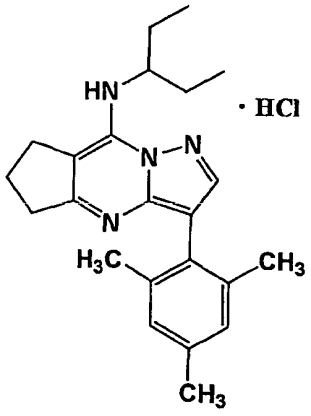


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 6.97 (brs, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.15 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.57 (s, 9H)。

実施例２（６２）

８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



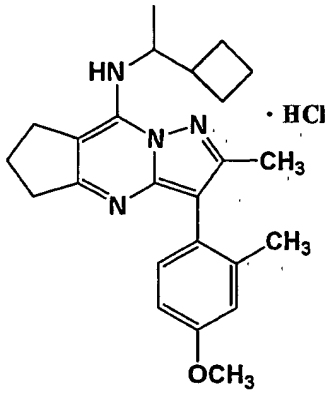
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.91 (s, 1H), 7.39 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 6.99 (s, 2H), 4.03 (m, 1H), 3.52 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.17 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.31 (m,

2H), 2.13 (s, 6H), 1.67-1.96 (m, 4H), 1.07 (t, J = 7. 5Hz, 6H)。

実施例２（６３）

８－（１－シクロブチルエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

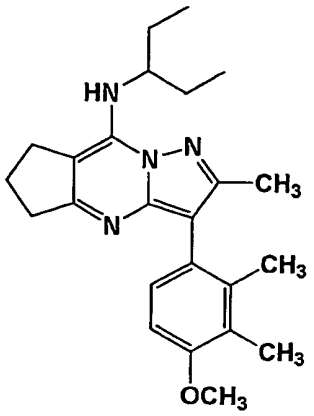


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.28（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, pyridine-d_5 0.5ml + $CDCl_3$ 0.1ml)：δ 7.46 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.80 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.96 (m, 1H), 3.74 (s, 3H), 2.97 (ddd, J = 14.1, 7.2, 7.2Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.50-2.36 (m, 1H), 2.47 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.05-1.65 (m, 8H), 1.15 (d, J = 6.3Hz, 3H)。

実施例２（６４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，３－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

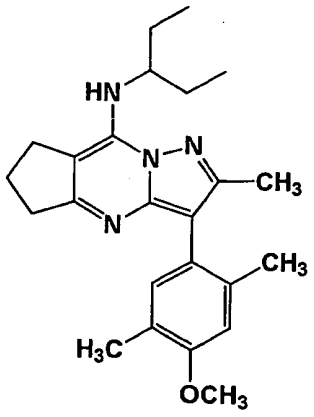


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.08 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.88 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.56-1.82 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.01 (t, J= 6.9Hz, 3H)。

実施例２（６５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，５－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

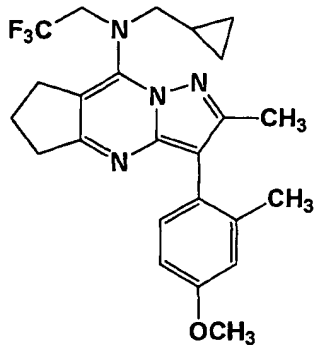


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.99 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.20 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.54-1.80 (m, 4H), 1.01 (m, 6H)。

実施例２（６６）

８－［Ｎ－（２，２，２－トリフルオロエチル）－Ｎ－シクロプロピルメチル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

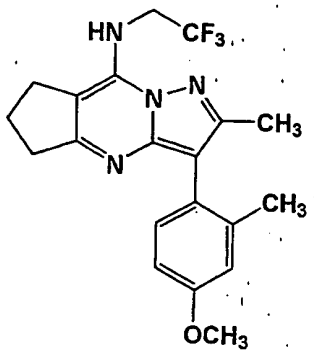


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.62（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.64 (q, J = 9.6Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 2.98 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.21-2.09 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.03 (m, 1H), 0.57 (m, 2H), 0.21 (m, 2H)。

実施例２（６７）

８－（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

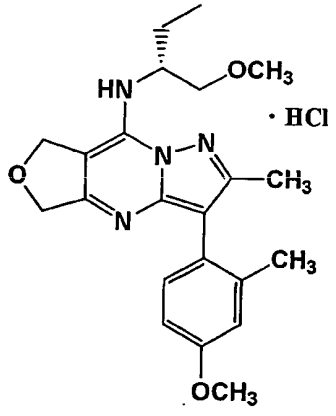


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.75 (brt, J = 7.8Hz, 1H), 4.22 (dq, J = 7.8, 7.8Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.23-2.09 (m, 2H), 2.17 (s, 3H)。

実施例２（６８）

８－［（２Ｒ）－１－メトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



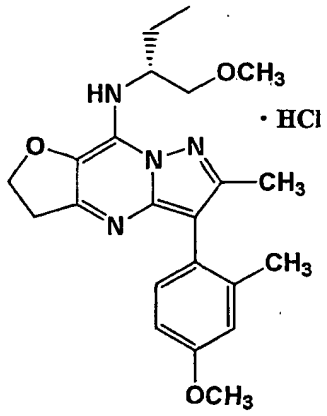
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.25（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, pyridine-d_5 0.5ml + $CDCl_3$ 0.1ml)：δ 7.39 (d, J = 8.1Hz, 1H),

7.37 (brd, J = 9.3Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.45 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.35 (d, J = 9.9Hz, 1H), 4.98 (brs, 2H), 3.74 (s, 3H), 3.63-3.48 (m, 3H), 3.26 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.82-1.60 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（６９）

８－［（２Ｒ）－１－メトキシブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－２，３－ジヒドロ－フロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



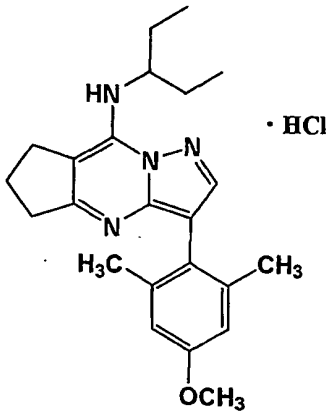
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, pyridine-d_5 0.5ml + $CDCl_3$ 0.1ml)：δ 7.40 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.03 (brs, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.80 (brd, J = 9.3Hz, 1H), 4.47 (m, 1H), 4.47 (t, J = 8.4Hz, 2H), 3.74 (s, 3H), 3.56 (d, J = 4.8Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 3.12 (t, J = 8.4Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.87-1.46 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（７０）

８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－

a］ピリミジン・塩酸塩

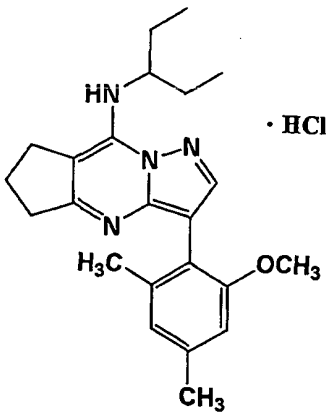


TLC：Rf 0.33（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.90 (s, 1H), 7.39 (br d, J = 10.2Hz, 1H), 6.72 (s, 2H), 4.02 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.53 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.17 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.32 (m, 2H), 2.14 (s, 6H), 1.66-1.96 (m, 4H), 1.08 (t, J = 7 .2Hz, 6H)。

実施例2（71）

8－（3－ペンチルアミノ）－3－（4，6－ジメチル－2－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

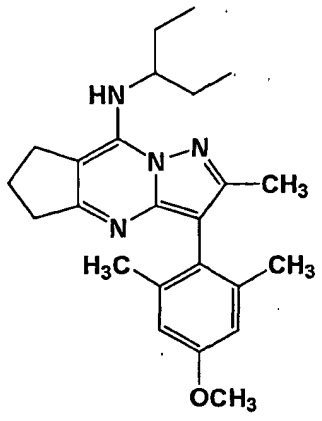


TLC：Rf 0.33（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.99 (s, 1H), 7.37 (br d, J = 10.8Hz, 1H), 6.75 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.57 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.16 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.63- 1.92 (m, 4H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（７２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

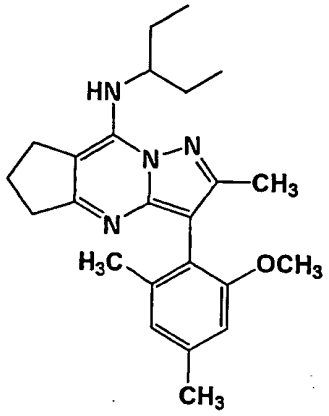


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 6.68 (s, 2H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.81 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 2.04 (s, 6H), 1.55-1.83 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（７３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（４，６－ジメチル－２－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

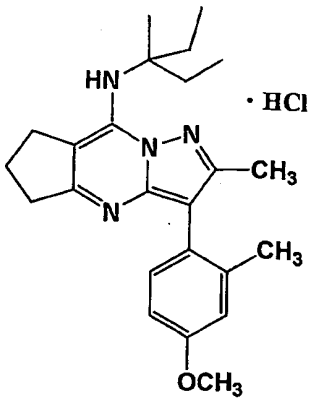


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.75 (m, 1H), 6.62 (s, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.06 (m, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 1.53-1.80 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（７４）

８－（３－メチルペンタン－３－イル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

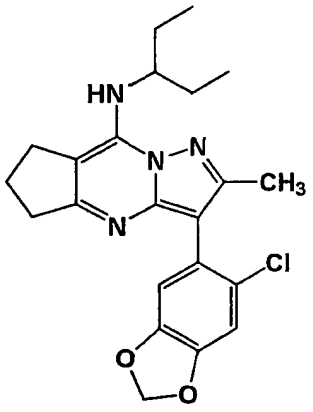


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.01 (brs, 1 H), 7.12 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1 H), 3.83 (s, 3 H), 3.52 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 3.16 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.28 (s, 3 H), 2.24 (m, 2 H), 2.20 (s, 3 H), 2.00-1.85 (m, 4 H), 1.55 (s, 3 H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6 H)。

実施例２（７５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（５－クロロ－１，３－ジオキサインダン－６－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

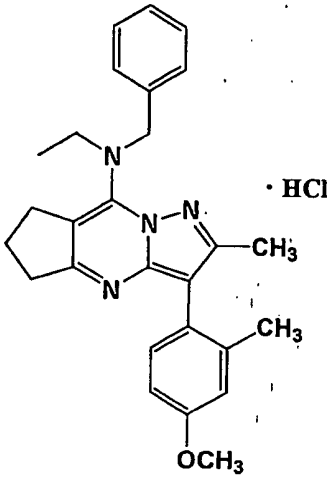


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.44（ベンゼン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.96 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.22 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 5.99 (s, 2H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.16 (m,2H), 1.53-1.81 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（７６）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ベンジルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

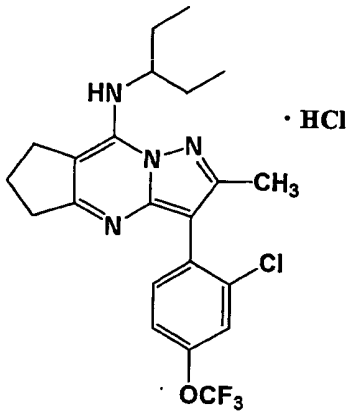


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.26-7.43 (m, 5H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.87 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.03 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.39 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（７７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－トリフルオロメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

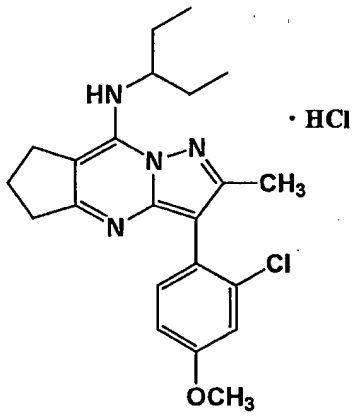


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, pyridene-d_5(0.5ml) ,$CDCl_3$(0.1ml)) : δ 7.71 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.28 (m, 1H), 6.77 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.74 (m, 1H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.85 (t, J =7.8Hz, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.98 (m, 2H), 1.64-1.48 (m, 4H), 0.92 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（７８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



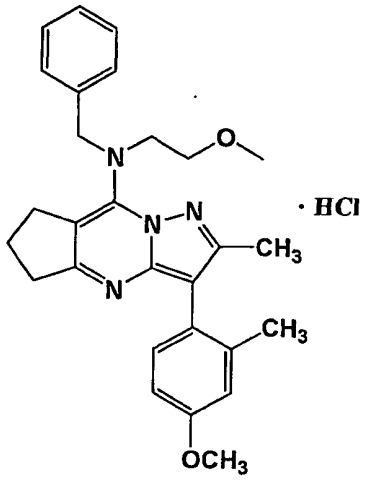
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, pyridene-d_5(0.5ml) ,$CDCl_3$(0.1ml)) : δ 7.59 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.4Hz,1H), 6.98 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.78 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.94 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.85 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.51 (s, 3H), 1.96 (m, 2 H), 1.64-1.48 (m, 4H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（７９）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－

3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

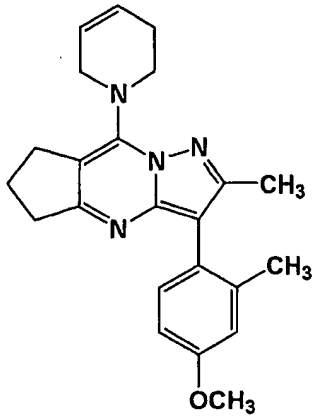


TLC：Rf 0.24（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 - 7.44 (m, 3H), 7.27 - 7.34 (m, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.14 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.64 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.49 (t, J =7.8Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 2.19 (s, 3H)。

実施例2（80）

8－（1，2，5，6－テトラヒドロピリジル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

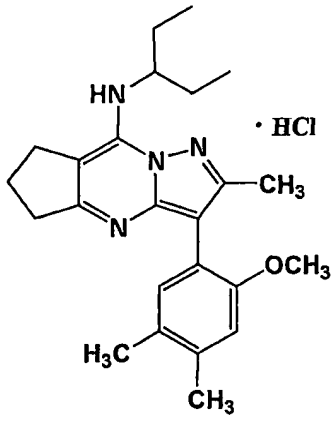


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, $CDCl_3$), 5.97 (m, 1H), 5.83 (m, 1H), 4.21 (m, 2H), 3.85 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.5H z, 2H), 2.41 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.11 (m, 2H)。

実施例２（８１）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－４，５－ジメチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

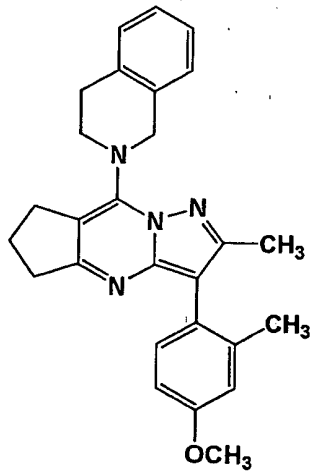


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.29 (brd, J = 10.2Hz, 1 H), 7.04 (s, 1 H), 6.83 (s, 1 H), 3.95 (m, 1 H), 3.90 (s, 3 H), 3.56 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.42 (s, 3 H), 2.31 (s, 3 H), 2.28 (m, 2 H), 2.24 (s, 3 H), 1.90 - 1.62 (m, 4 H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 6 H)。

実施例２（８２）

８－（１，２，３，４－テトラヒドロイソキノリン－２－イル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［d］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



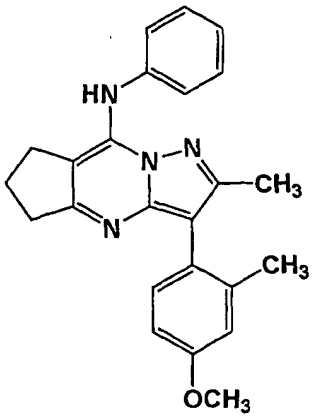
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.24（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.23 - 7.18 (m, 3 H), 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 7.11 (m, 1 H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1 H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1 H), 4.86 (s, 2 H), 4.09 (t, J = 5.7Hz, 2 H), 3.82 (s, 3 H), 3.08 (t, J = 5.7Hz, 2 H), 2.97 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.33 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.08 (m, 2 H)。

実施例２（８３）

８－フェニルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニ

ル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

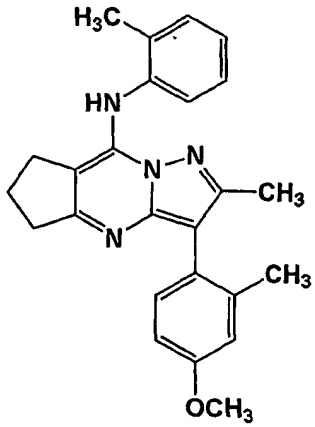


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 8.01 (br, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 2H), 7.33 - 7.17 (m, 4H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.30 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.02 - 1.90 (m, 2H)。

実施例２（８４）

８－（２－メチルフェニル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

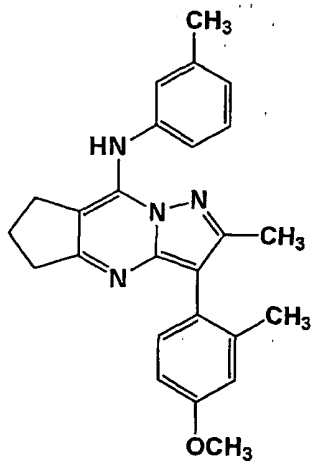


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.76 (br, 1H), 7.32 - 7.17 (m, 5H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.85 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 6H), 2.22 (s, 3H), 2.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 1.96 - 1.85 (m, 2H)。

実施例２（８５）

８－（３－メチルフェニル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



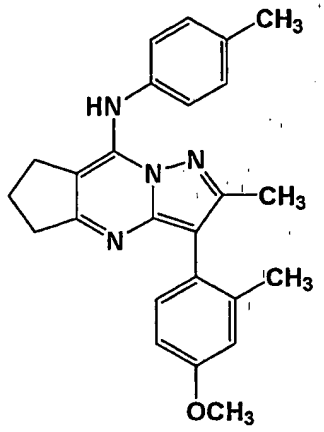
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.96 (br, 1H), 7.32 - 7.26 (m, 1H), 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.12 - 7.01 (m, 3H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.31 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.02 - 1.91 (m, 2H)。

実施例２（８６）

８－（４－メチルフェニル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾ

ロ［1，5－a］ピリミジン

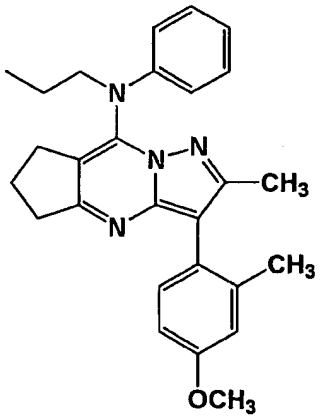


TLC：Rf 0.33（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.93 (br, 1H), 7.23 - 7.11 (m, 5H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.29 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.00 - 1.88 (m, 2H)。

実施例2（87）

8－（N－フェニル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

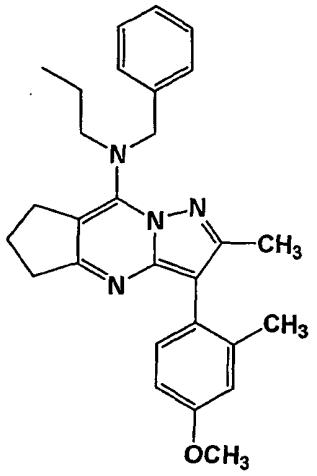


TLC：Rf 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 - 7.24 (m, 2H), 7.21 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.99 - 6.87 (m, 4H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.15 - 4.07 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.31 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.05 - 1.94 (m, 2H), 1.82 - 1.68 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（８８）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



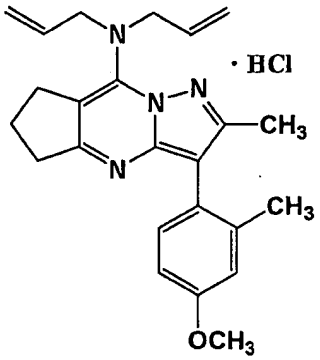
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.63（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 - 7.21 (m, 5H), 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.34 (m, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.1Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.11 - 1.98 (m, 2H), 1.67 - 1.54 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（８９）

８－（Ｎ，Ｎ－ジアリルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メ

トキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

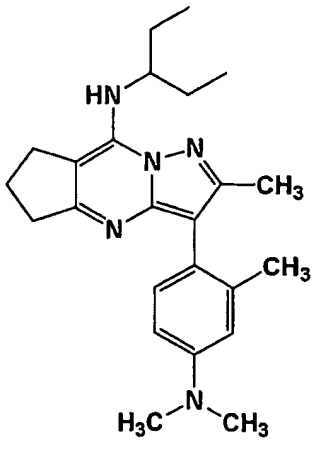


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J =2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.03 (m, 2H), 5.40 (d, J = 10.5Hz, 2H), 5.35 (d, J = 18Hz, 2H), 4.49 (d, J = 6.0Hz, 4H), 3.83 (s, 3H), 3,47 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 2.18 (s, 3H)。

実施例２（９０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－ジメチルアミノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

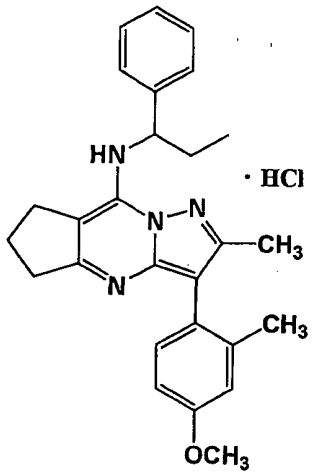


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.17（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.70 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.64 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1 H), 6.19 (d, J = 10.2Hz, 1 H), 3.80 (m, 1 H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.95 (s, 6 H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.32 (s, 3 H), 2.18 (s, 3 H), 2.18 - 2.08 (m, 2 H), 1.80 - 1.56 (m, 4 H), 1.01 (brs, 6 H)。

実施例２（９１）

８－（１－フェニルプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

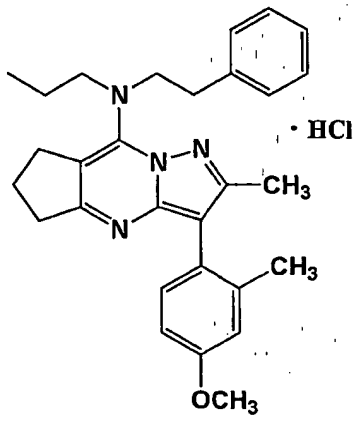


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.83 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.27 - 7.48 (m, 5H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (m, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.10 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.41 (m, 2H), 3.16 (m, 1H), 2.83 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 2.12 (m, 4H), 1.12 and 1.01 (t, J = 7.2Hz, total 3H)。

実施例２（９２）

８－（Ｎ－（２－フェニルエチル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

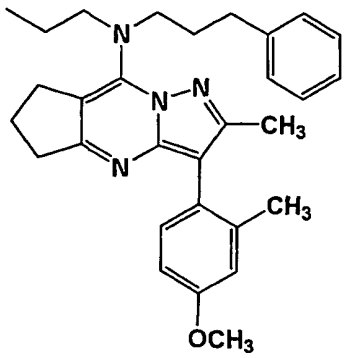


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.23 - 7.05 (m, 6H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.33 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.9Hz, 2H), 3.37 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.77 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.20 - 2.06 (m, 2H), 1.81 - 1.68 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（９３）

８－（Ｎ－（３－フェニルプロピル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

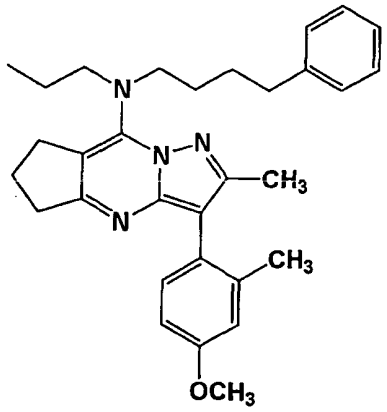


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.26 - 7.05 (m, 6H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.66 - 3.53 (m, 4H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.87 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.15 - 2.04 (m, 2H), 1.95 - 1.83 (m, 2H), 1.61 - 1.49 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（９４）

８－（Ｎ－（４－フェニルブチル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



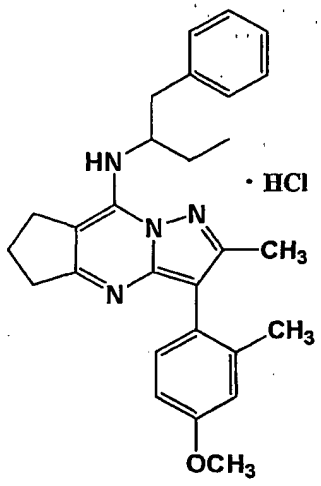
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 - 7.05 (m, 6H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd,

J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.63 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.57 - 3.49 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.57 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.15 - 2.05 (m, 2H), 1.66 - 1.49 (m, 6H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（９５）

８－（１－フェニル－２－ブチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



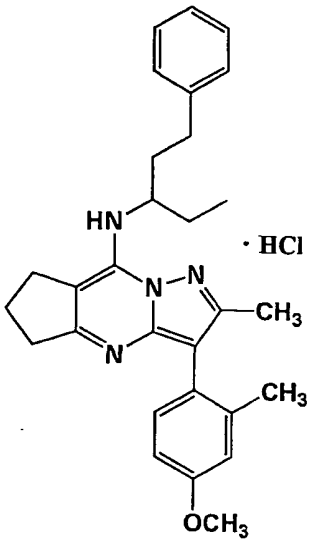
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 9.24 (m, 1H) 7.04 - 7.30 (m, 6H), 6.95 (br s, 1H), 6.86 (dd, J =2.7, 8.4Hz, 1H), 4.20 (br s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.87 - 3.17 (m, 3H), 2.64 - 2.87 (m, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.82 - 2.18 (m, 5H), 1.63 - 1.82 (m, 2 H), 0.93 (br t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（９６）

８－（１－フェニル－３－ペンチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］

ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

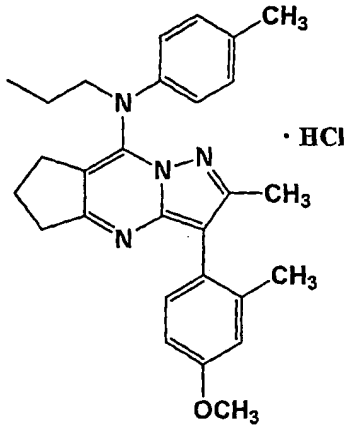


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, DMSO-d_6)：δ 8.53 (m, 1H), 7.09 - 7.28 (m, 6H), 6.96 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.10 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.89 - 3.02 (m, 3H), 2.68 - 2.85 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.00 - 2.22 (m, 7H), 1.79 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（９７）

８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

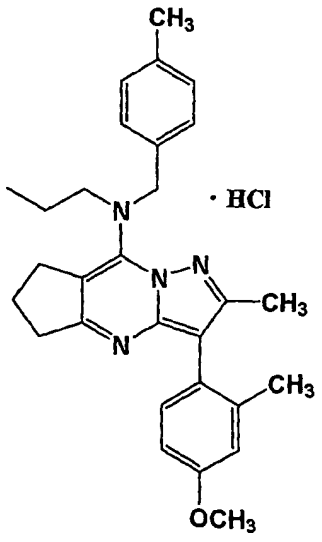


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.13 - 7.22 (m, 3H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.46 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.77 - 1.97 (m, 6H), 0.98 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（９８）

８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

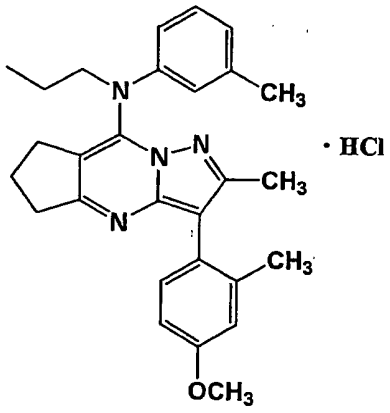


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 - 7.21 (m, 5H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.72 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.48 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（９９）

８－（Ｎ－（３－メチルフェニル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



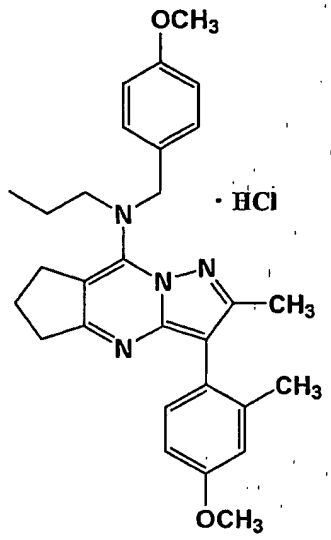
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 (m, 1H), 7.06 - 7.24 (m, 4H), 6.91 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 4.46 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.77 - 2.00 (m, 6H), 0.99 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１００）

８－（Ｎ－（４－メトキシフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－

５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

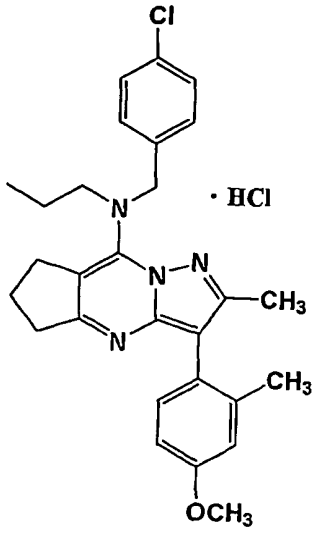


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.18 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90(d, J = 8.7Hz, 2H), 6.90 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.70 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.49 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.75 (m, 2H), 0.93 (t, J= 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１０１）

８－（Ｎ－（４－クロロフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

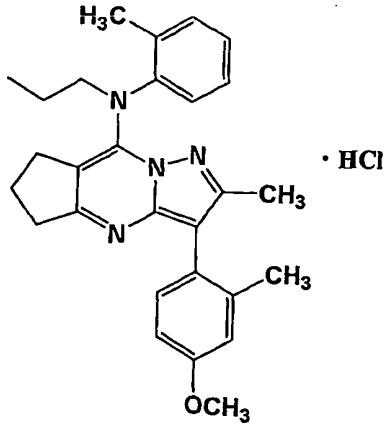


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.37 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.24 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.68 (m, 2H), 3.50 (t, J =7.8Hz, 2H), 3.02 (t, J= 7.2Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.74 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１０２）

８－（Ｎ－（２－メチルフェニル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

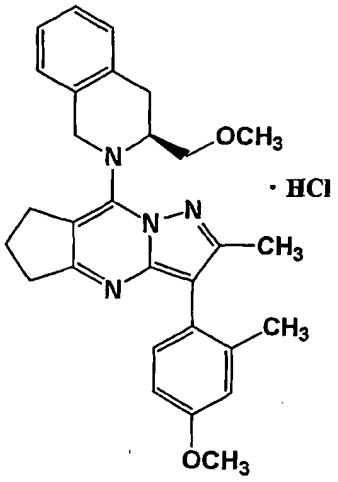


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 - 7.45 (m, 4H), 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 4.53 (m, 1H), 4.37 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.50 - 2.07 (m, 6H), 0.97 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１０３）

８－（（３Ｓ）－３－メトキシメチル－１，２，３，４－テトラヒドロイソキノリン－２－イル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

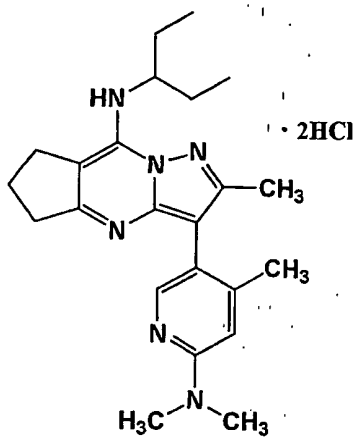


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 - 7.05 (m, 5H), 6.90 - 6.75 (m, 2H), 5.48 (m, 1H) 5.03 (d, J = 15.6Hz, 1H), 4.72 (dd, J = 15.6, 3.9Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.33 and 3.32 (s, 3H), 3.87 - 3.05 (m, 7H), 2.82 (d, J = 15.6Hz, 1H), 2.40 - 2.10 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.25 and 2.11 (s, 3H)。

実施例２（１０４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－ジメチルアミノ－４－メチルピリジン－５－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

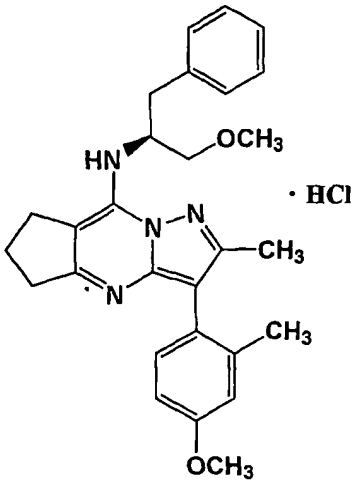


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（クロロホルム：メタノール＝２０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.01 (s, 1H), 7.32 (d, J = 10.2Hz, 1H), 6.85 (s, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.41 (s, 6H), 3.40 (m, 2H), 3.17 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.33 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.65 - 1.95 (m, 4H), 1.07 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１０５）

８－（（２Ｓ）－１－メトキシ－３－フェニル－２－プロピル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

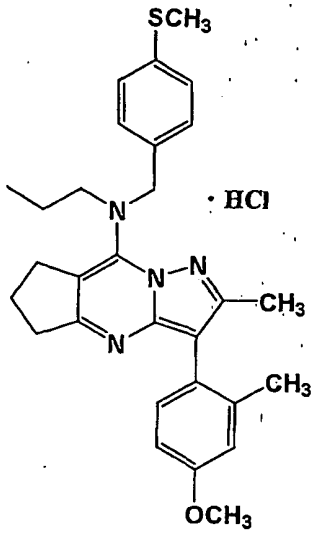


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.77 (m, 1H), 7.25 - 7.36 (m, 3H), 7.16 - 7.23 (m, 2H), 7.11 (m, 1H), 6.88 (m, 1H), 6.80 (m, 1H), 4.44 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.53 - 3.68 (m, 2H), 3.47 and 3.46 (s, 3H), 3.38 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz , 2H), 3.08 (m, 1H), 2.81 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.20 and 2.17 (s, 3H), 2.15 (m, 2H)。

実施例２（１０６）

８－（Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

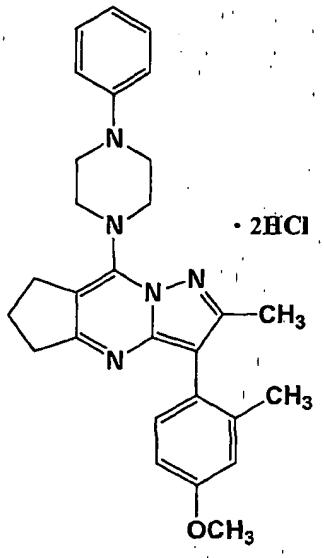


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.50 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.75 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１０７）

８－（４－フェニルピペラジン－１－イル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

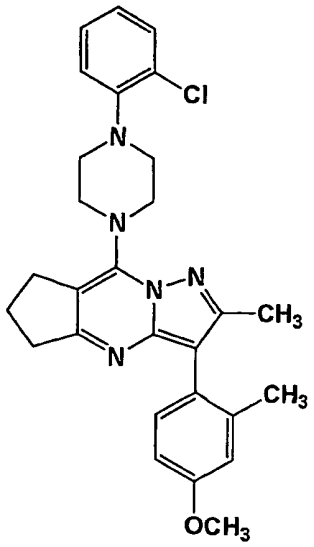


TLC：Rf 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.30 - 7.38 (m, 2H), 7.21 - 7.29 (m, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.00 (brd, J = 6.9Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.22 (br s, 4H), 3.79 (s, 3H), 3.53 (brs, 4H), 3.14 (m, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 2.06 (s, 3H)。

実施例２（１０８）

８－（４－（２－クロロフェニル）ピペラジン－１－イル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

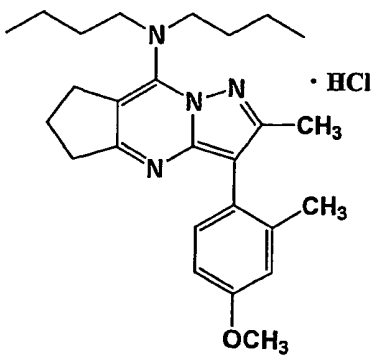


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.41 (dd, J = 1.5, 7.8Hz, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (m, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.90 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.33 (t, J = 4.8H, 4H), 3.16 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.14 (m, 2H)。

実施例２（１０９）

８－（Ｎ，Ｎ－ジブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

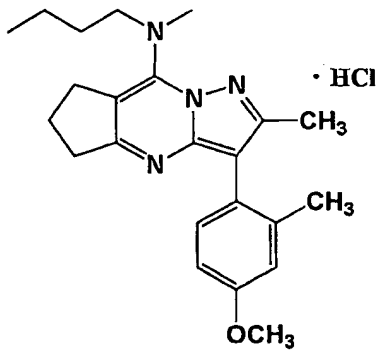


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.12 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.4, 7.8Hz, 1H), 3.90 (t, J = 7.5Hz, 4H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.02 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.71 (m , 4H), 1.38 (m, 4H), 0.97 (t, J = 6.9Hz, 6H)。

実施例２（１１０）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



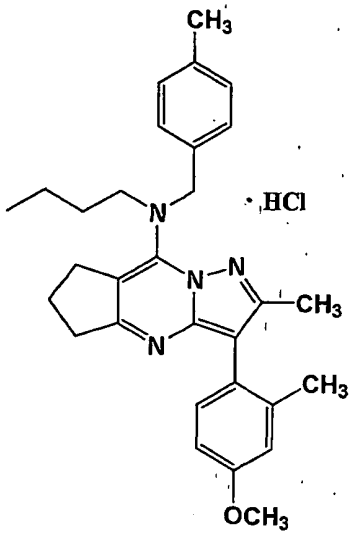
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 3.0, 8.1Hz, 1H), 3.97 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.45 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.12 (t, J= 6.9Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.23 (m, 2 H), 2.18 (s, 3H), 1.85 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１１１）

８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ

ーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

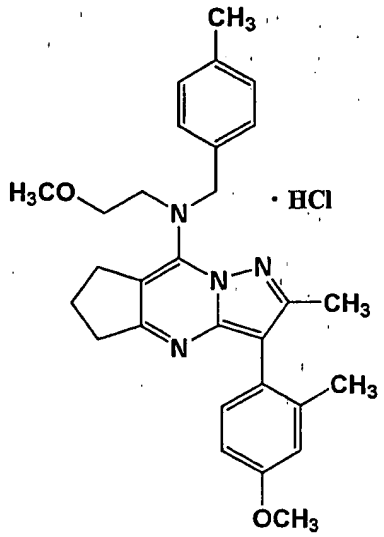


TLC：Rf 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 - 7.21 (m, 5H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.77 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.48 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.73 (m, 2H), 1.34 (m, 2H), 0.93 (t, J= 7.2Hz, 3H)。

実施例2（112）

8－（N－（4－メチルフェニル）メチルーN－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロー5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

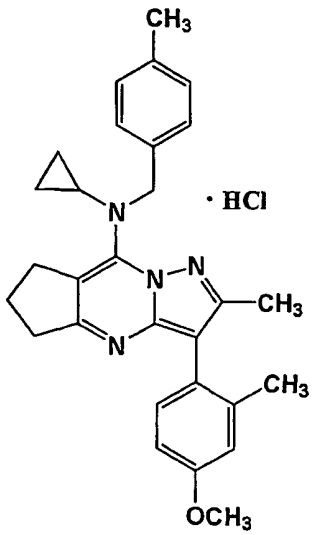


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.23（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 - 7.05 (m, 5H), 6.98 - 6.78 (m, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.22 - 4.03 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.75 - 3.58 (m, 2H), 3.58 - 3.38 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.20 - 2.90 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 2.19 (s, 3H)。

実施例２（１１３）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

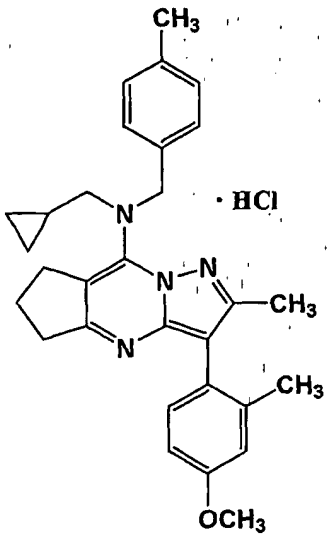


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 - 6.95 (m, 5H), 6.95 - 6.73 (m, 2H), 5.40 - 5.15 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.30 - 2.95 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.30 - 2.10 (m, 3H),2.19 (s, 3H), 1.10 - 0.80 (m, 4H)。

実施例２（１１４）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

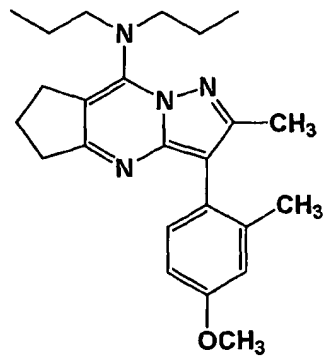


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 - 7.00 (m, 5H), 7.00 - 6.75 (m, 2H), 5.24 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.80 - 3.60 (m, 2H), 3.60 - 3.35 (m, 2H), 3.20 - 2.90 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (s, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.38 - 1.05 (m, 1H) , 0.75 - 0.50 (m, 2H), 0.35 - 0.10 (m, 2H)。

実施例２（１１５）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

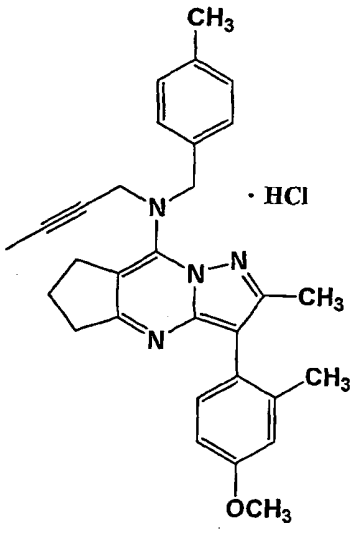


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.59（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.56 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.58 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（１１６）

８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

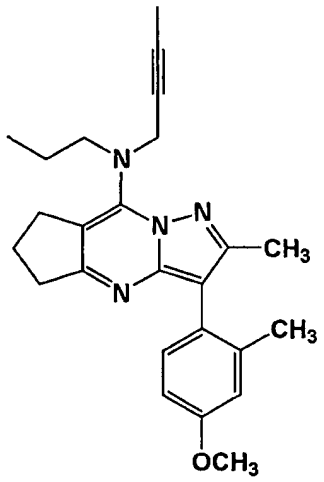


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J= 8.1Hz, 2H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.27 (d, J = 15.0Hz, 1H), 5.24 (d, J = 15.0Hz, 1H), 4.41 (m, 2H), 3 .83 (s, 3H), 3.51 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.91 (t, J = 2.4Hz, 3H)。

実施例２（１１７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

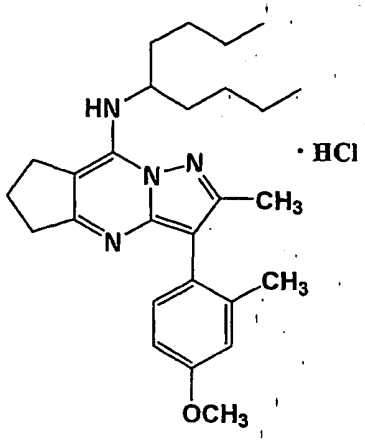


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.40 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.55 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.66 (m, 2H), 0.95 (t, J= 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１１８）

８－（５－ノニルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

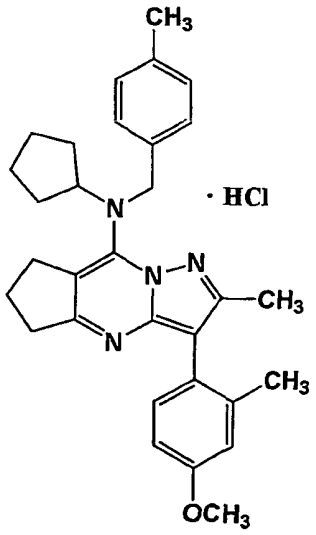


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (brd, J = 10.5Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.10 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.12 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.61 - 1.88 (m, 4H), 1.30 - 1.53 (m, 8H), 0.94 (m, 6H)。

実施例２（１１９）

８－（Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

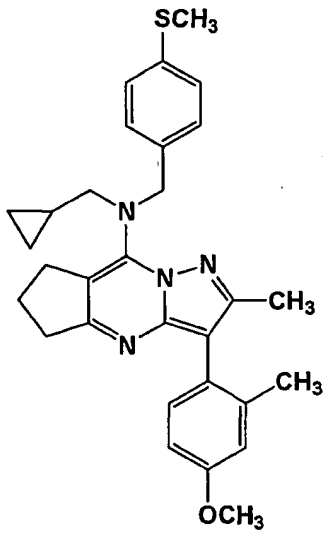


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, CD_3OD)：δ 7.20 - 6.98 (m, 5H), 6.93 (d, J = 2.4Hz, 1H) 6.85 (dd, J = 8.6, 2.4Hz, 1H), 5.20 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.09 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.02 - 4.70 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.17 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.98 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 2.40 - 1.60 (m, 10H)。

実施例２（１２０）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

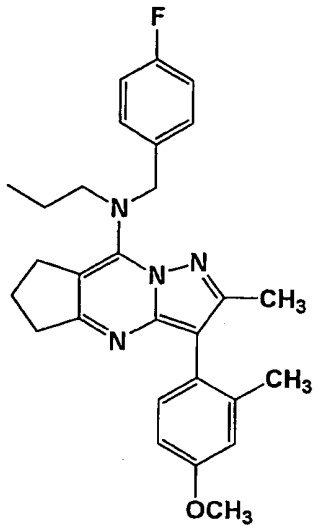


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.85（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 - 7.16 (m, 5H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.95 (m, 1H), 0.52 - 0.42 (m, 2H), 0.10 - 0.05 (m, 2H)。

実施例２（１２１）

８－（Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

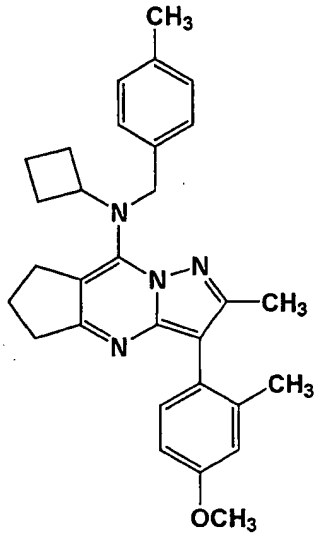


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.87（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 - 7.16 (m, 3H), 7.03 - 6.95 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.40 - 3.32 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2. 36 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.07 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１２２）

８－（Ｎ－シクロブチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

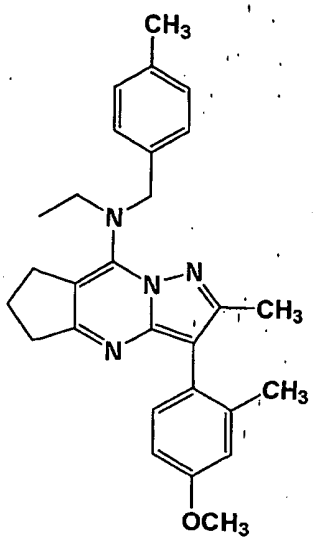


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.5Hz, 2H), 6.89 (d, J = 7.5Hz, 2H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 4.90 - 4.70 (m, 2H), 4.08 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.84 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.61 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.20 - 2.06 (m, 4H), 1.96 (m, 2H), 1.80 - 1.60 (m, 2H)。

実施例２（１２３）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

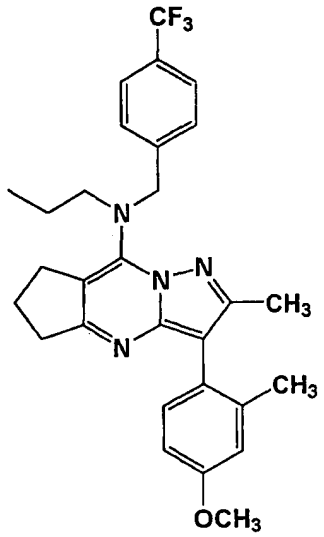


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.69（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ　7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.14 - 7.06 (m, 4H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.47 (q, J = 6.9Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.81 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.04 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.18 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（１２４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

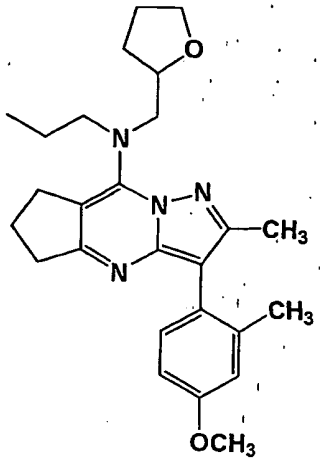


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.79（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.57 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.44 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.49 - 3.25 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.87 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１２５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（テトラヒドロフラン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

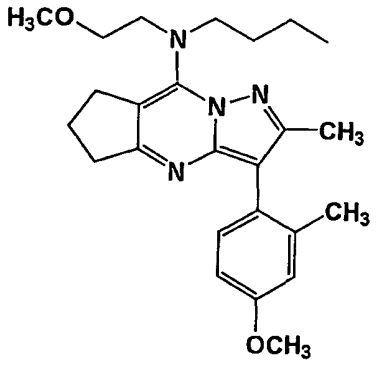


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.31（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J= 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.84 - 4.06 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.64 - 3.80 (m, 3H), 3.50 - 3.64 (m, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.74 - 2,00 (m, 3H), 1.42 - 1.65 (m, 3H), 0.89 (t, J= 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１２６）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

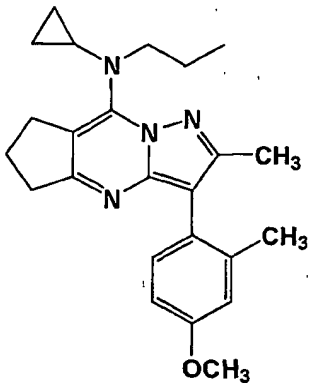


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.92 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.57 (m, 2H), 3.50 (t, J= 5.7Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 0.90 (t, J= 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１２７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

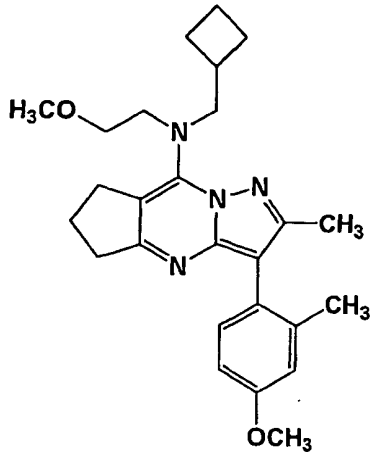


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.19 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.07 (m, 1H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.80 - 0.68 (m, 4H)。

実施例２（１２８）

８－（Ｎ－シクロブチルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

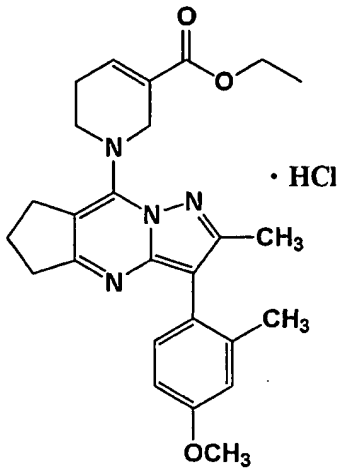


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.82 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.64 (d, J = 7.5Hz, 2H), 3.49 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.62 - 2.50 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 2.06 - 1.58 (m, 6H)。

実施例２（１２９）

８－（３－エトキシカルボニル－１，２，５，６－テトラヒドロピリジル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

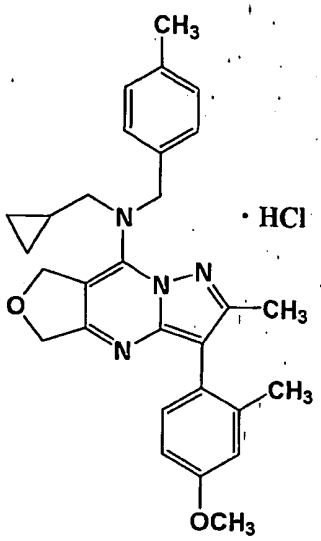


TLC：Rf 0.27（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.62 (m, 2H), 4.27 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.20 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.16 (t, J = 6.0Hz, 2H), 2.85 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.34 (t, J= 6.9 HZ, 3H)。

実施例２（１３０）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

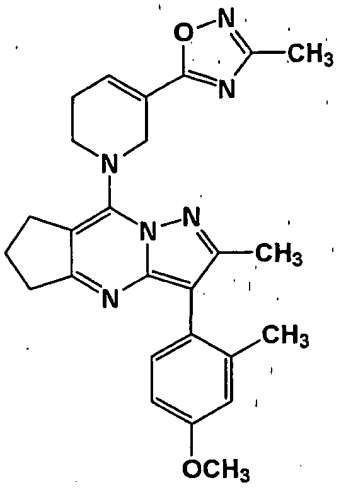


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.68（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.21 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.16 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.13 (d, J= 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (brs, 2H), 5.27 (m, 2H), 5.22 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m, 1H), 0.67 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例２（１３１）

８－（３－（３－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－５－イル）－１，２，５，６－テトラヒドロピリジル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

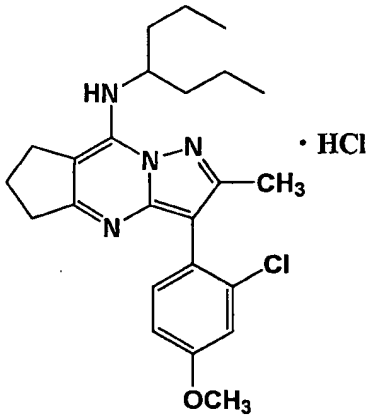


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.18（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (m, 1H), 7.15 (d, J= 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.57 (m, 2H), 3.94 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.71 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.14 (m, 2H)。

実施例２（１３２）

８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

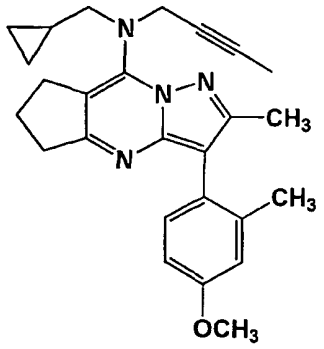


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.37 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.13 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.66 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.60 - 1.84 (m, 4 H), 1.34 - 1.60 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１３３）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



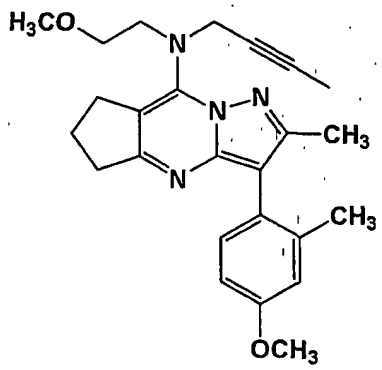
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.73（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.54 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.20 - 1.16 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.36 - 0.28 (m, 2H)。

実施例２（１３４）

８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－

メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

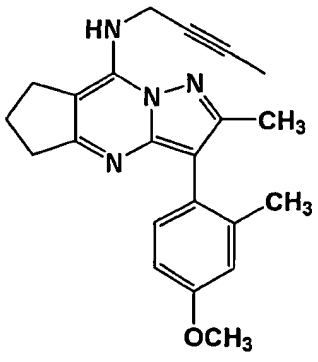


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.13（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.44 - 4.39 (m, 2H), 3.92 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 3.13 (t, J = 7 .2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.7Hz, 3H)。

実施例２（１３５）

８－（２－ブチリルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

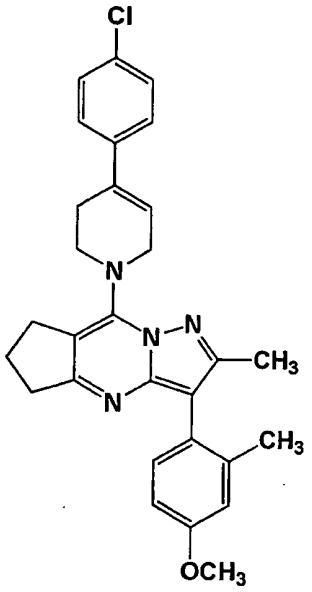


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.53 (t, J = 6.9Hz, 1H), 4.36 - 4.30 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.25 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2 .31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.08 (m, 2H), 1.83 (t, J = 2.1Hz, 3H)。

実施例２（１３６）

８－（４－（４－クロロフェニル）－１，２，５，６－テトラヒドロピリジル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

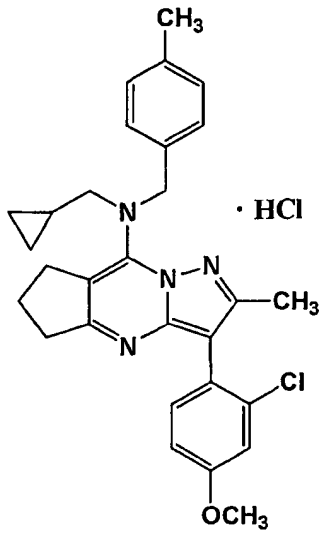


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.10（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.22 - 6.18 (m, 1H), 4.50 - 4.32 (m, 2H), 4.10 - 3.90 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.10 (t, J = 6.9Hz, 2 H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.82 - 2.69 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H)。

実施例２（１３７）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

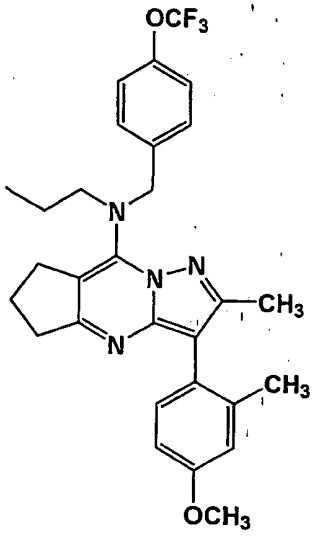


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (d, J = 15.9Hz, 1H), 5.21 (d, J = 15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.36 - 3.62 (m, 2H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.23 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H)。

実施例２（１３８）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

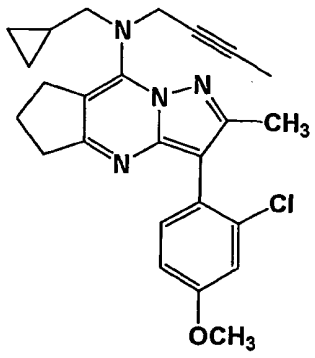


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.15 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 - 3.35 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.83 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.19 - 2.00 (m, 2H), 1.66 - 1.54 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１３９）

８－（Ｎ－（２－ブチリル）－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

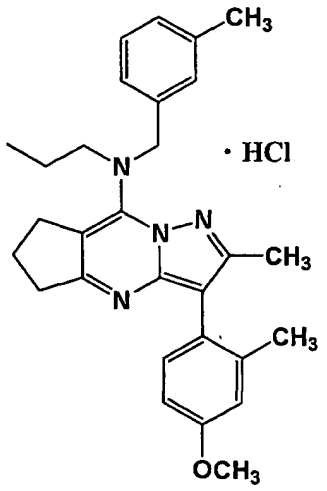


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.54 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.52 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.16 - 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.32 - 0.26 (m, 2H)。

実施例２（１４０）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

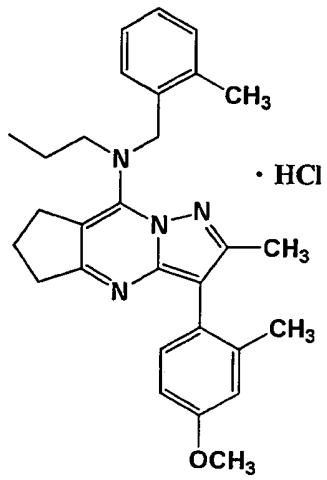


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.05 (m, 2H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.49 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.02 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１４１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

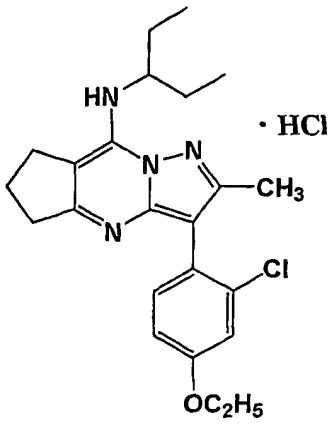


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.18 - 7.30 (m, 4H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.49 (t, J = 6.9Hz, 2H), 3.00 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.79 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１４２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－エトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

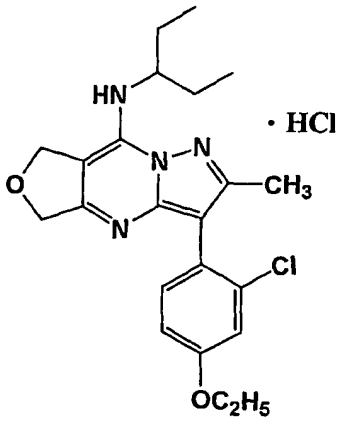


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ　7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.07 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 3.34 - 3.65 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.62 - 1.93 (m, 4H), 1.42 (t, J = 6. 9Hz, 3H), 1.06 (t, J= 7.5Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１４３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－エトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

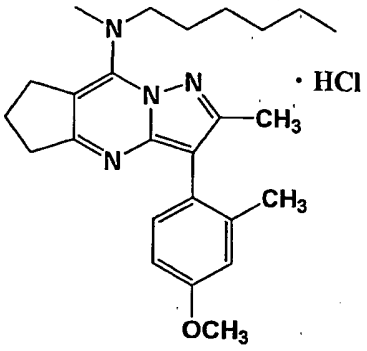


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.49 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.28 (brs, 2H), 4.07 (m, 2H), 3.40 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98 (m, 4H), 1.43 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１４４）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－ヘキシルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

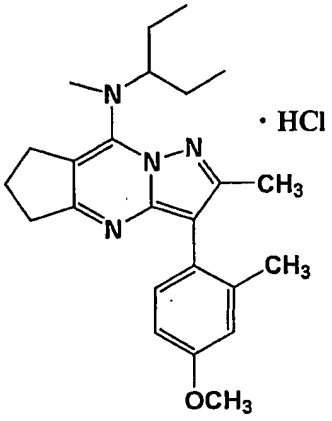


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.09（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.01 - 3.95 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.51 - 3.42 (m, 2H), 3.18 - 3.06 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.26 - 2.18 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.96 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.25 (m, 6H), 0.90 (brt, J = 6.6Hz, 3H)。

実施例２（１４５）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－（３－ペンチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

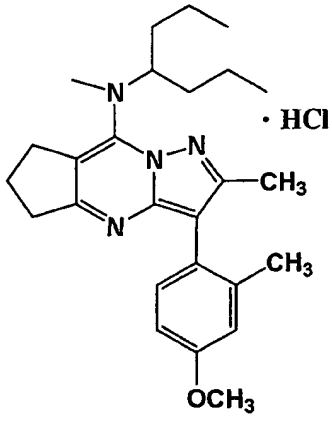


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.46 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.10 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.45 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.76 - 1.98 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１４６）

８－（Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ヘプチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

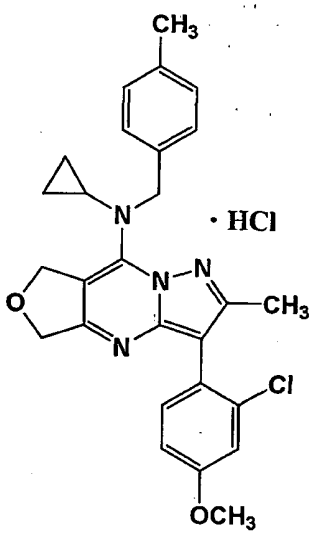


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)： δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.80 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.64 - 1.94 (m, 4H), 1.28 - 1.58 (m,4H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１４７）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

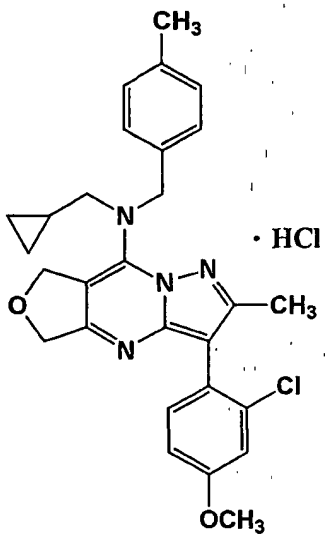


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)： δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.18 - 5.30 (m, 4H), 5.15 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.67 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 0.85 - 1.00 (m, 4H)。

実施例２（１４８）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

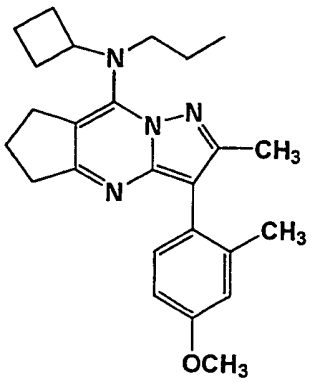


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.10 - 5.50 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.22 (m, 2H)。

実施例２（１４９）

８－（Ｎ－シクロブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

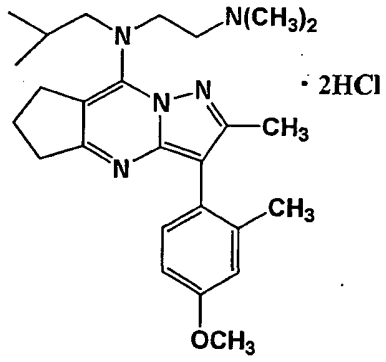


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.17 (,d J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.35 (quint, J = 7.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.69 - 3.10 (m, 2H), 2.94 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 - 2.02 (m, 9H), 1.78 - 1.58 (m, 2H), 1.39 (sext, J = 7.8Hz, 2H), 0.84 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

実施例２（１５０）

８－（Ｎ－イソブチル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩



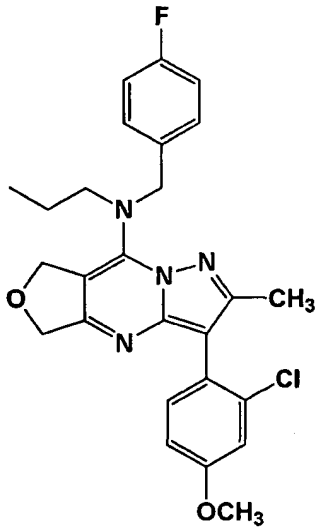
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.63（酢酸エチル：酢酸：水＝３：１：１）；

NMR (300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.91 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.08 - 3.98 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.50 - 3.42 (m, 2H),

3.42 - 3.32 (m, 2H), 3.01 (brt, J = 6.9Hz, 2H), 2.87 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.77 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 1.80 - 1.64 (m, 1H), 0.83 (d, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例２（１５１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



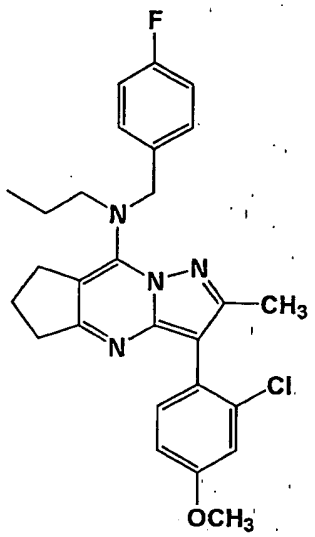
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d, J = 3.0Hz, 1H), 7.05 - 6.97 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.7, 3.0Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.33 - 3.27 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.63 (sext, J = 7.8Hz, 2H), 0.39 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

実施例２（１５２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－

5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン

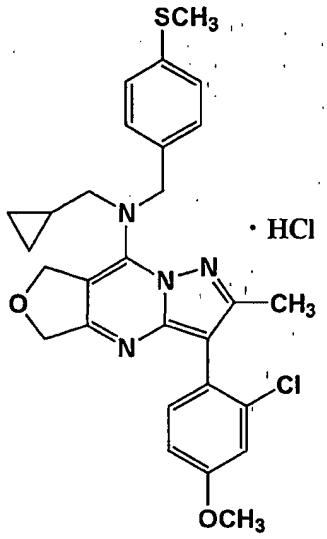


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.28 - 7.20 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.02 - 6.94 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 (brt, J = 7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz , 2H), 2.82 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１５３）

８－（Ｎーシクロプロピルメチルー Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

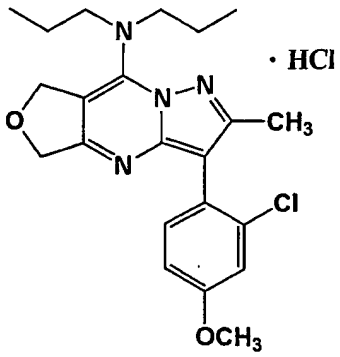


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.67（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.37 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.33 (d, J = 15.9Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.24 (d, J = 15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例２（１５４）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

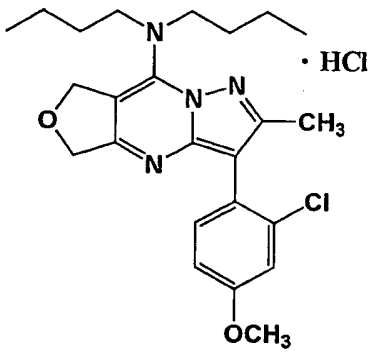


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.69（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.48 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H), 5.36 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H), 5.21 (t, J = 1.8Hz, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１５５）

８－（Ｎ，Ｎ－ジブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



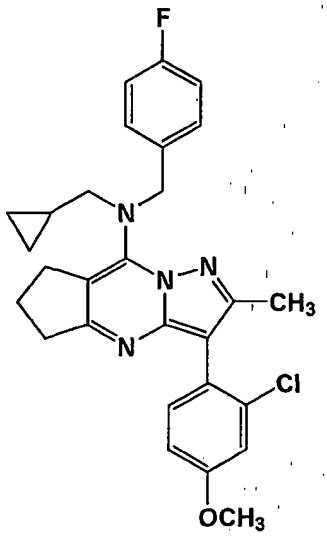
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.74（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.47 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.88 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.79 (m , 4H), 1.42 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１５６）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７

－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

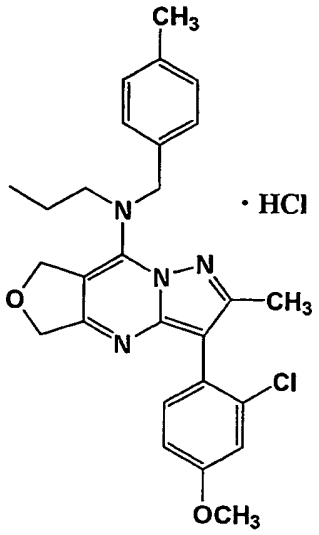


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.27（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 - 7.26 (m, 3H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.01 - 6.95 (m, 2H), 6.88 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.39 (s, 3H), 2.10 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.49 - 0.42 (m, 2H), 0.08 - 0.02 (m, 2H)。

実施例２（１５７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

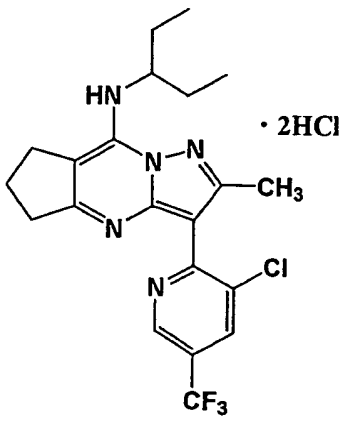


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.28 (m, 2H), 5.13 (m, 2H), 5.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (m, 2 H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１５８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（３－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジン－２－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

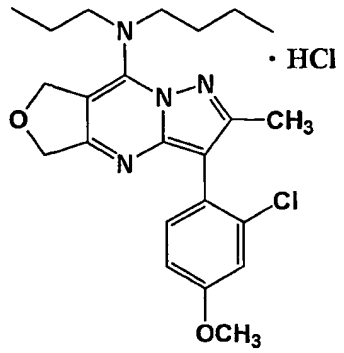


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.19（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.91 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.32 (m, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.06 (brt, J = 6.9Hz, 6H)。

実施例２（１５９）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

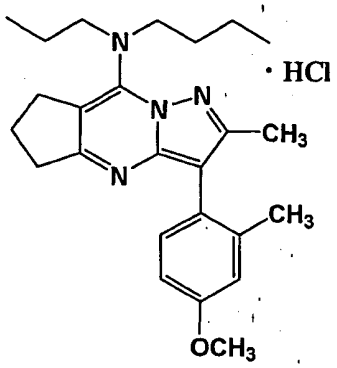


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.21（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.47 and 5.35 (ABd, J = 16.5Hz, 2H), 5.21 (brs, 2H), 4.00 - 3.75 (m) and 3.85 (s) total 7H, 2.34 (s, 3H), 1.90 - 1.75 (m, 4H), 1.42 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 1.05 - 0.98 (m, 6H)。

実施例２（１６０）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

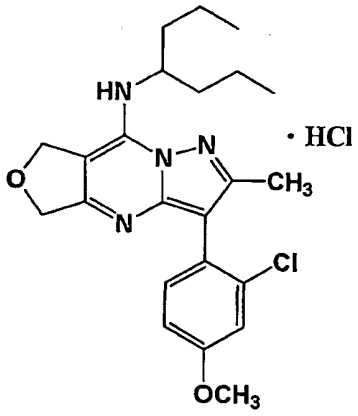


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.95 - 3.80 (m) and 3.83 (s) total 7H, 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.30 - 2.18 (m) and 2.27 (s) total 5H, 2.19 (s, 3H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.38 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１６１）

８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



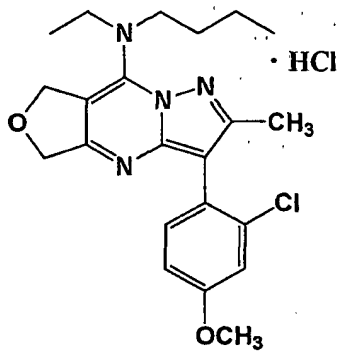
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.52 (d, J = 10.2Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08

(d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.49 (brd. J = 16.8Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.28 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.53 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 1.75 (m, 4H), 1.47 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１６２）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

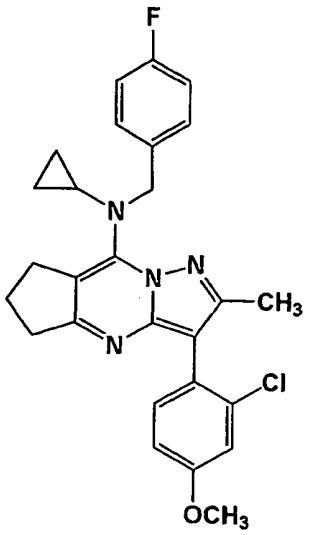


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.46 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 5.23 (t, J = 1.5Hz, 2H), 3.80 - 4.00 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 1 .46 (t, J= 7.2Hz, 3H), 1.44 (m, 2H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１６３）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

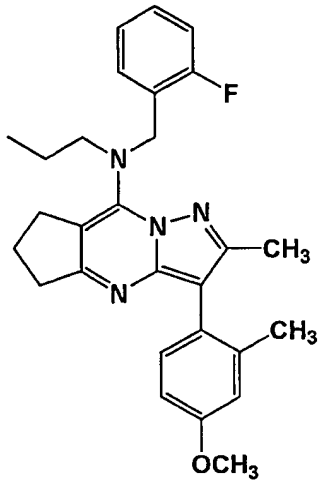


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 - 6.93 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.97 - 2.86 (m, 4H), 2.75 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.03 (m, 2H), 0.80 - 0.68 (m, 4H)。

実施例２（１６４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

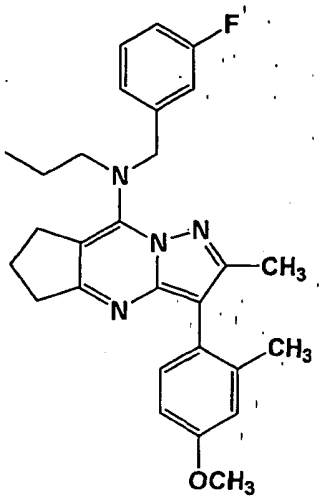


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.85（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.24 - 7.12 (m, 2H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 - 6.97 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.00 - 4.92 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.75 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.02 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.46 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１６５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

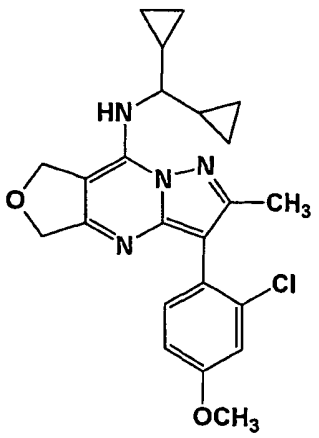


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.86（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 - 7.01 (m, 2H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.52 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１６６）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

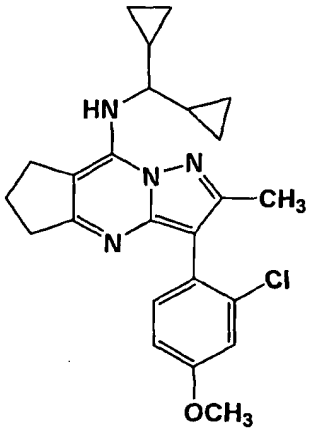


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.39（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 6.48 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 5.22 (brs, 2H), 4.89 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.87 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 1.15 (m, 2H), 0.61 (m, 4H), 0.42 (m, 4H)。

実施例２（１６７）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



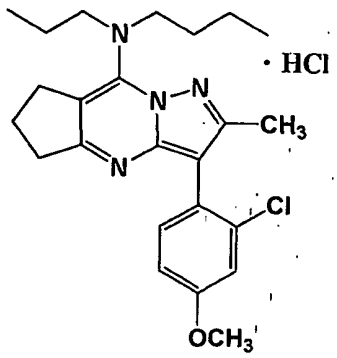
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 6.37 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.40 (m, 1H) 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.14 (m, 2H), 0.50 - 0.66 (m, 4H), 0.35 - 0.50 (m, 4H)。

実施例２（１６８）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］

ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

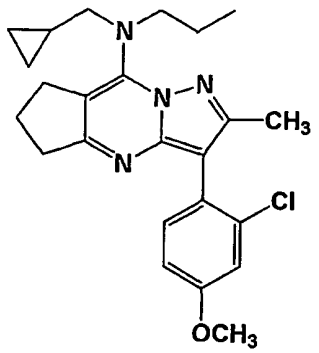


TLC：Rf 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 1H), 4.00 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.10 - 2.95 (m, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.43 - 1.30 (m, 2H), 0.97 (t, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例2（169）

8－（N－シクロプロピルメチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン



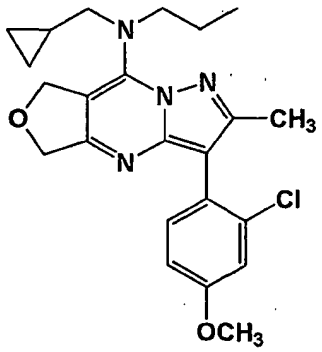
TLC：Rf 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.64 - 3.58 (m, 2H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.65 - 1.55 (m, 2H), 1.05 - 0.90 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.50 - 0.40 (m, 2H), 0.15 - 0.05 (m, 2H)。

実施例２（１７０）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

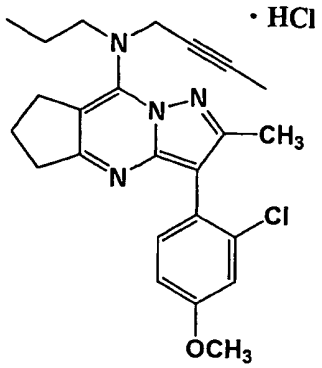


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 2.38 (s, 3H), 1.63 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.56 - 0.46 (m, 2H), 0.15 (dd, J = 10.8, 5.1Hz, 2H)。

実施例２（１７１）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

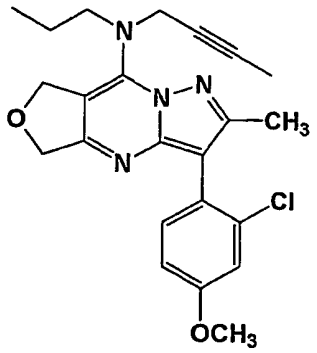


TLC：Rf 0.44（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.96 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 4.56 (d, J = 2.1Hz, 2H), 4.05 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 5H, 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.25 - 3.10 (m, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.95 - 1.80 (m) and 1.89 (s) total 5H, 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１７２）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



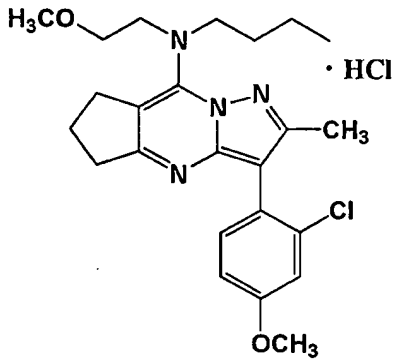
TLC：Rf 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.45 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.84 (s,

3H), 3.55 - 3.45 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.72 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１７３）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

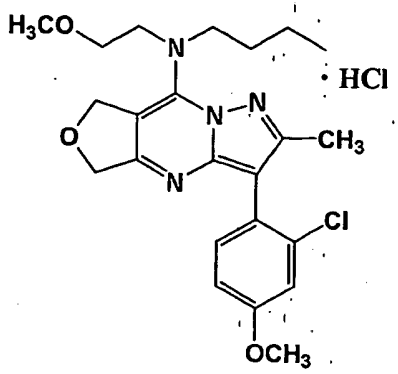


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1Hz. 1H), 6.97 (brd, J = 7.8Hz, 1H), 4.30 - 4.18 (m, 2H), 3.90 - 3.78 (m) and 3.85 (s) total 5H, 3.70 - 3.30 (m) and 3.64 (m) total 4H, 3.30 (s, 3H), 3.08 - 2.98 (m, 2H), 2.40 - 2.18 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 2H), 1.43 - 1.35 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１７４）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

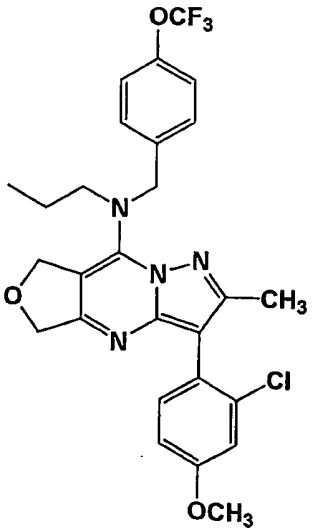


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.39（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (brs, 1H), 7.05 - 6.95 (m, 1H), 5.60 - 5.35 (m, 2H), 5.30 - 5.15 (m, 2H), 4.40 - 4.20 (m, 2H), 3.90 - 3.70 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.35 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.85 - 1.70 (m, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 0.99 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（１７５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

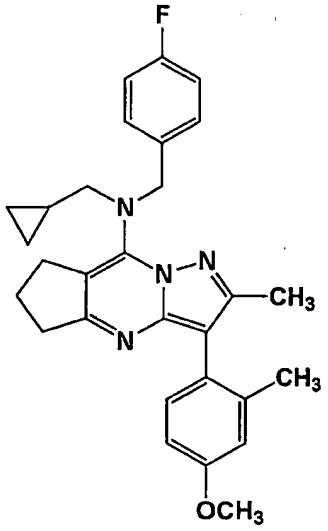


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.39 - 7.33 (m, 2H), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.21 - 7.15 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 - 3.28 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.54 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１７６）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

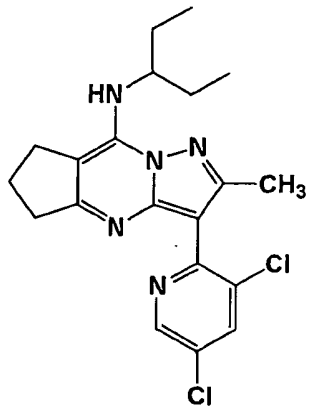


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.28（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 - 7.26 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.03 - 6.94 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.95 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 6.9Hz, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.58 - 0.42 (m, 2H), 0.20 - 0.01 (m, 2H)。

実施例２（１７７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（３，５－ジクロロピリジン－２－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

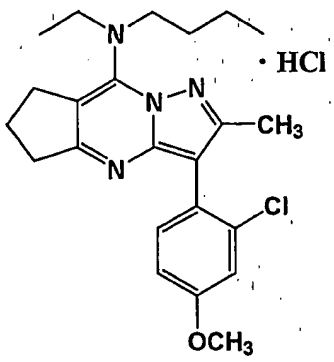


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.58 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.81 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.24 (brd, J = 11.1Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.80 - 1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（１７８）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

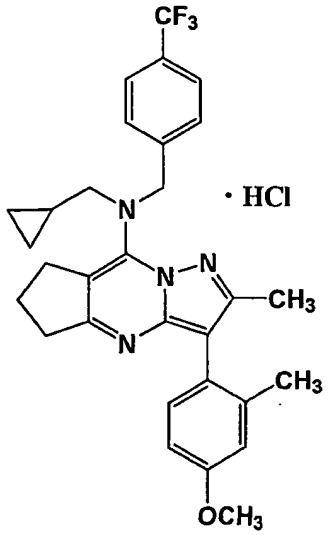


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.94 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.30 - 3.62 (m, 2H), 3.05 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.32 - 1.48 (m, 5H), 0.98 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

実施例２（１７９）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

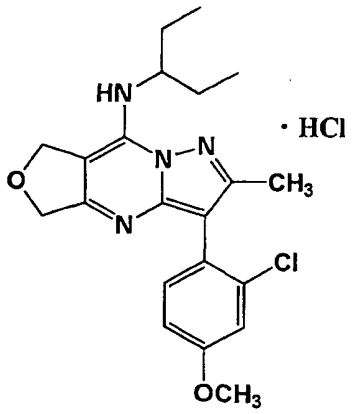


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.65 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (m, 2H), 3.52 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.14 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.17 (m, 2H)

実施例２（１８０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



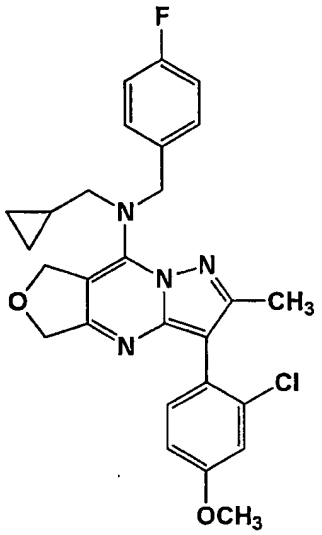
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.50 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.39 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98 (m, 4H), 1.06 (m, 6H)。

実施例２（１８１）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メ

チルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

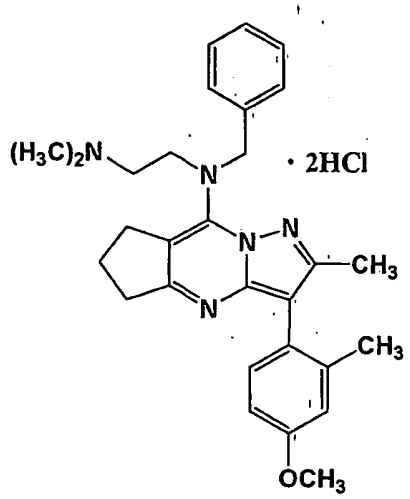


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.28（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 - 7.28 (m, 2H), 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.901 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9 H z, 2H), 2.40 (s, 3 H), 1.08 - 0.94 (m, 1H), 0.56 - 0.48 (m, 2H), 0.14 - 0.06 (m, 2H)。

実施例２（１８２）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

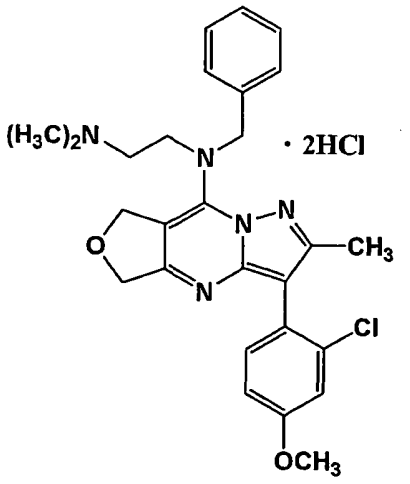


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（酢酸エチル：酢酸：水＝３：１：１）；

NMR(300MHz, CD_3OD)：δ 7.45 - 7.32 (m, 5H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.40 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 3.06 (m, 2H), 2.96 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 2.38 - 2.18 (m, 2H), 2.11 (s, 3H)。

実施例２（１８３）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩

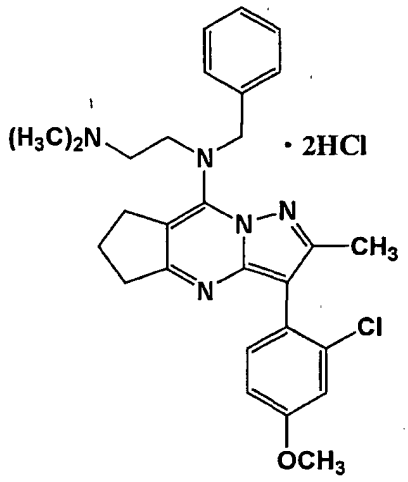


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（酢酸エチル：酢酸：水＝３：１：１）；

NMR(300MHz, CD_3OD)：δ 7.60 - 7.30 (m, 6H), 7.19 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 4.40 - 4.24 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 (m, 1H), 3.56 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2 .44 (s, 3H)。

実施例２（１８４）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・２塩酸塩



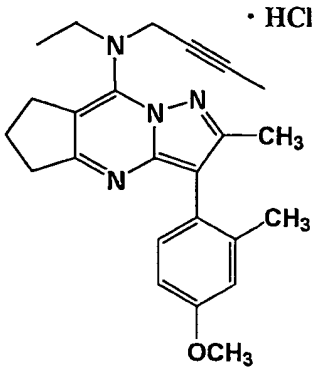
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.27（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, CD_3OD)：δ 7.46 - 7.26 (m, 6H), 7.20 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.34 - 4.20 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 - 3.64 (m, 2H), 3.34 - 2.86 (m) and 2.96 (s) total 10H, 2.41 (s, 3H), 2.26 - 2.10 (m, 2H)。

実施例２（１８５）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペン

タ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

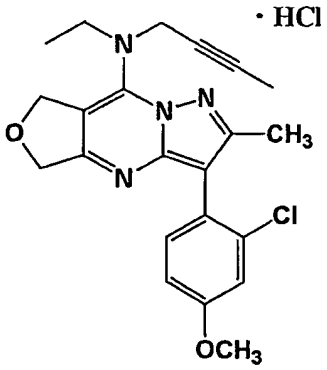


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.55 (q, J = 2.1Hz, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.90 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１８６）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

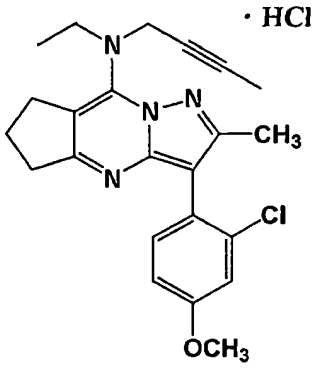


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 5.36 (m, 2H), 4.46 (m, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.89 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.51 (t , J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１８７）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

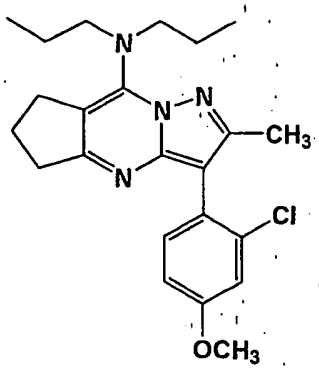


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.32（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300Hz, $CDCl_3$): δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.54 (m, 2H), 4.09 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.64 (m, 2H), 3.22 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (S, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.90 (t, J = 2. 4Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１８８）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

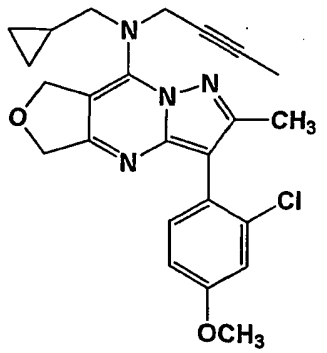


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.58 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１８９）

８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



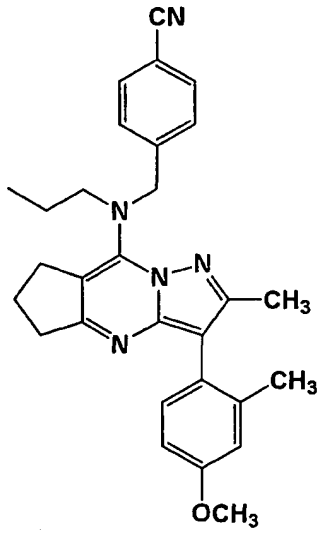
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（トルエン：アセトン＝５：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.56 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.64 - 0.56 (m, 2H), 0.38

- 0.28 (m, 2H)。

実施例２（１９０）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

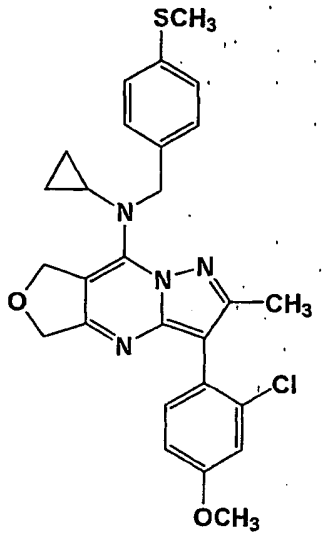


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.60 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.47 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H),. 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.94 - 2.82 (m, 4H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.59 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（１９１）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

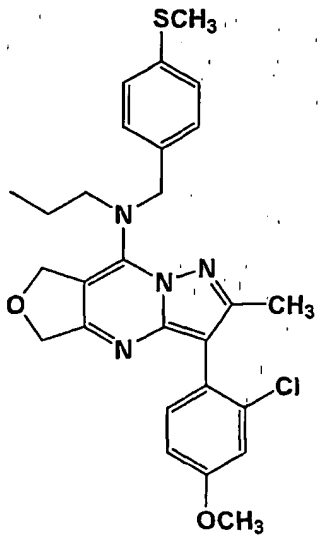


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 - 7.13 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.06 - 7.01 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 0.95 - 0.88 (m, 4H)。

実施例２（１９２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

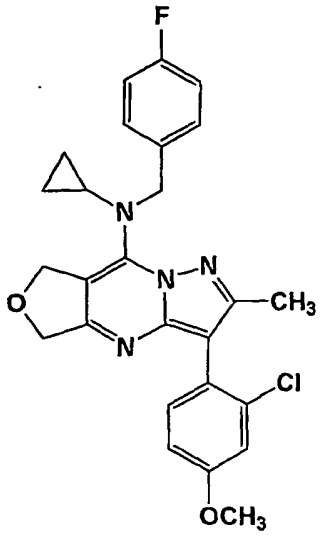


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.25（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１９３）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

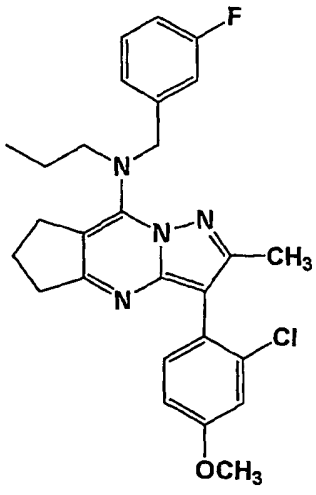


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.19（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.14 - 7.04 (m, 3H), 7.02 - 6.94 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.55 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.90 - 0.76 (m, 4H).

実施例２（１９４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

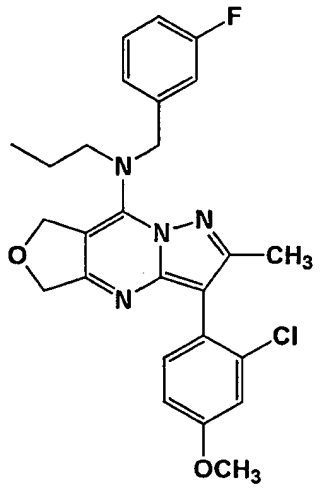


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 2H) 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.77 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.04 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.63 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１９５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

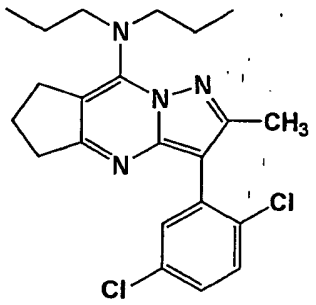


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.28 - 7.16 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.07 - 6.99 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.13 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.68 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（１９６）

８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２，５－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

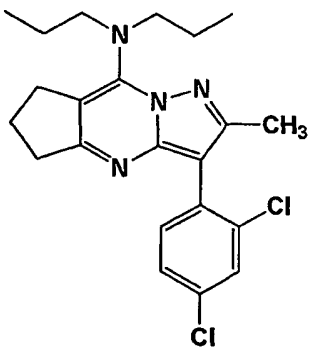


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.64（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.41 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.8Hz) and 2.93 (t, J = 7.8Hz) total 4H, 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.65 - 1.50 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１９７）

８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２，４－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

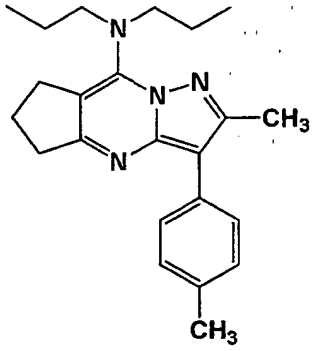


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.51 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.2Hz) and 2.92 (t, J = 7.2Hz) total 4H, 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（１９８）

８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（４－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

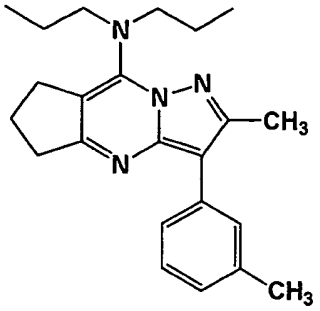


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.58 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.24 (d, J = 7.8Hz, 2H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 3.00 - 2.90 (m, 4H), 2.56 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.64 - 1.48 (m, 4H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（１９９）

８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（３－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

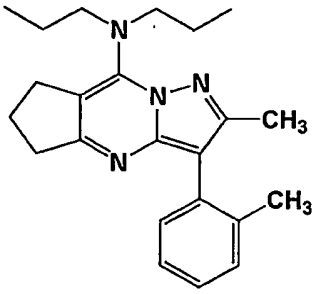


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.50 (s) and 7.47 (d, J = 7.5Hz) total 2H, 7.32 (t, J = 7.5Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.5Hz, 1H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 4H), 2.57 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.64 - 1.45 (m, 4H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２００）

８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

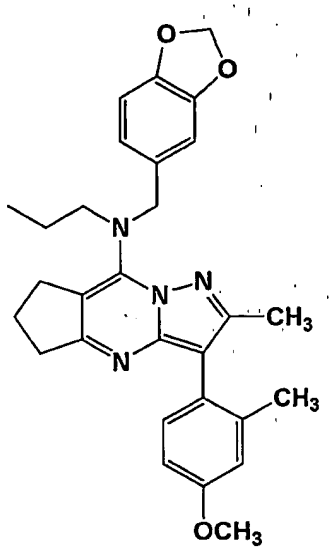


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 - 7.20 (m, 4H), 3.62 - 3.54 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.2Hz) and 2.90 (t, J = 7.2Hz) total 4H, 2.34 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.63 - 1.50 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２０１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

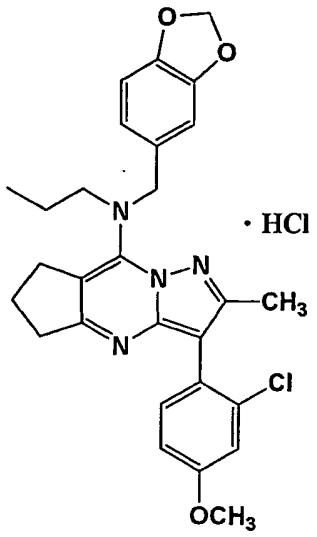


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.31（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 - 6.83 (m, 2H), 6.67 - 6.75 (m, 2H), 5.94 (s, 2H), 4.74 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.85 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2 .35 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.08 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.88 (t, J= 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２０２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

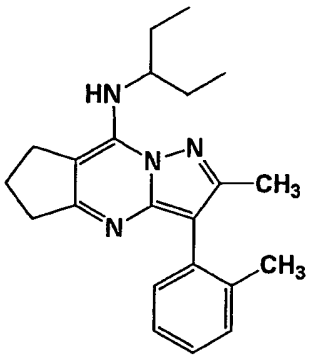


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.70 - 6.82 (m, 3H), 6.00 (s, 2H), 5.07 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (m, 2H), 3.36 - 3.64 (m, 2H), 3.03 (t, J = 7.4Hz, 2H) , 2.35 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２０３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

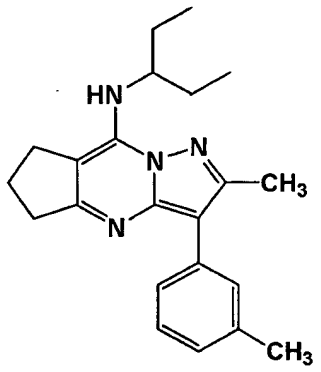


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.39（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 - 7.18 (m, 4H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.90 - 3.75 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.58 (m, 4H), 1.08 - 0.96 (m, 6H)。

実施例２（２０４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（３－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

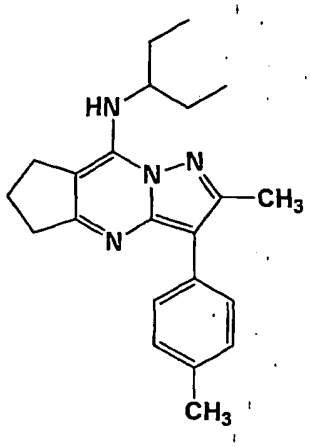


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.50 (s, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.86 - 3.74 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２０５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（４－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

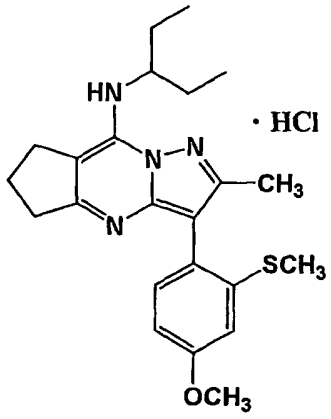


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.57 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.24 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.20 (10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.2Hz, 2H),2.55 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２０６）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチルチオ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

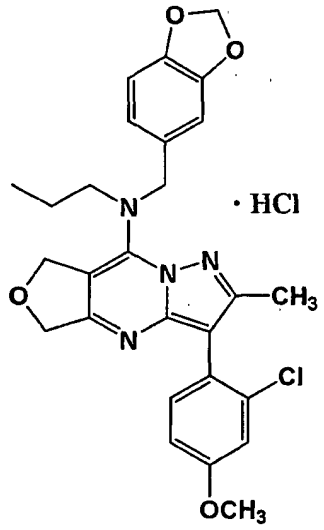


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.10（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.26 - 7.16 (m, 1H), 6.83 (m, 1H), 6.84 - 6.76 (m, 1H), 3.97 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.95 - 1.44 (m, 4H), 1.11 - 0.99 (m, 6H)。

実施例２（２０７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



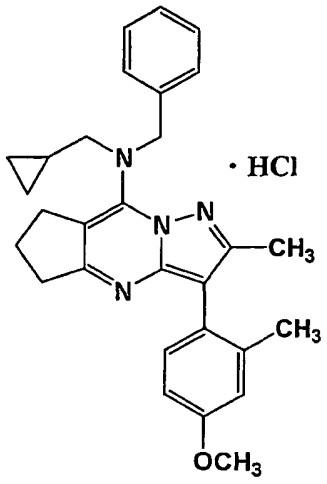
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 6.78 - 6.83 (m, 2H), 6.72 (m, 1H), 5.99 (s, 2H), 5.28 (m, 2H), 5.16 (s, 2H), 5.04 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２０８）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３

－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

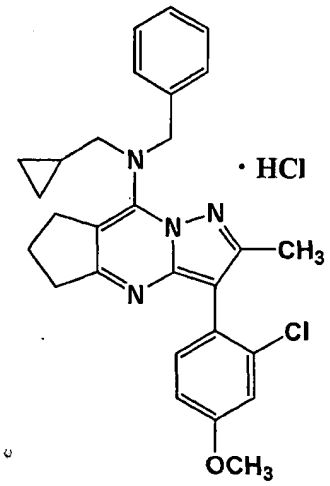


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.25 - 7.43 (m, 5H), 7.13 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 7.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 3.48 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.16 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H)。

実施例２（２０９）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

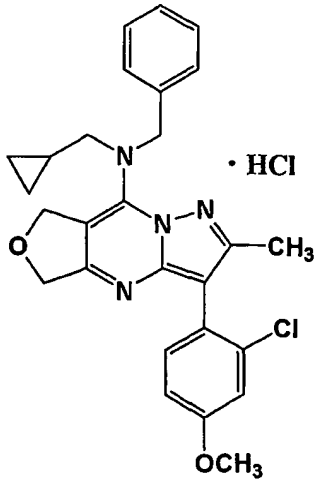


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 - 7.43 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd,J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.27 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.68 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.07 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.16 (m, 1H), 0.64 (m, 2H), 0.18 (m, 2H)。

実施例２（２１０）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

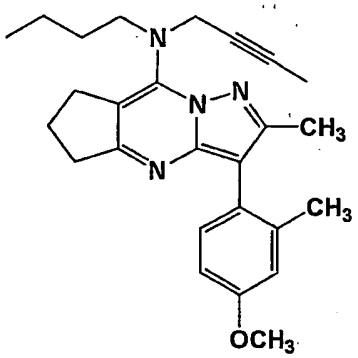


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.26 - 7.45 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.36 (m, 2H), 5.28 (m, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.66 (m, 2H), 0.22 (m, 2H)。

実施例２（２１１）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

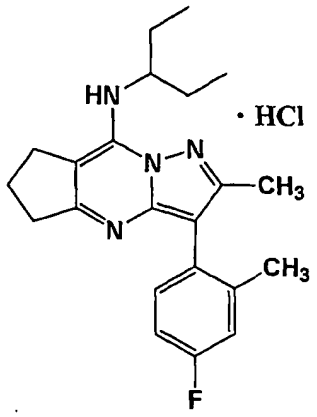


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.40 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2. 18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.63 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２１２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－フルオロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

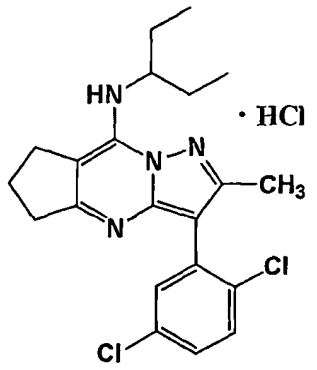


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.44（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 4.03 - 3.85 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.95 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m) and 2.12 (s) total 5H, 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.95 - 0.85 (m, 6H)。

実施例２（２１３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，５－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



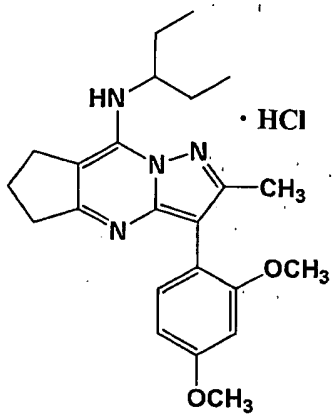
ＴＬＣ：Ｒｆ　0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.68 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.62 - 7.55 (m) and 7.59 (s) total 2H, 4.03 - 3.85 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.96 (brt, J = 7.8Hz, 2H),

2.32 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２１４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，４－ジメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

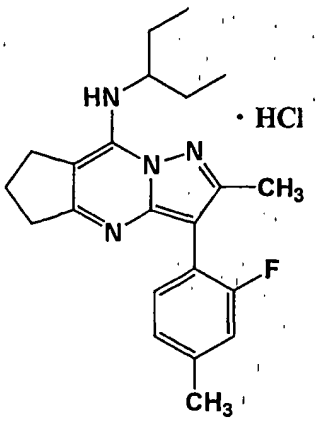


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.24 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.71 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.66 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 4.05 - 3.85 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.74 (s, H), 3.15 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.99 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.63 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２１５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－フルオロ－４－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

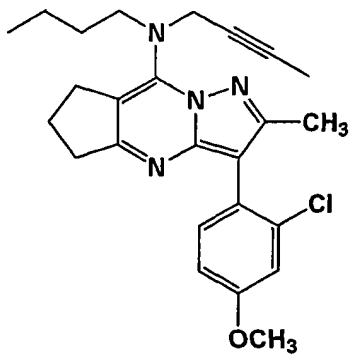


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6): δ 9.20 - 9.00 (m, 1H), 7.39 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.22 (d, J = 11.1Hz, 1H), 7.17 (d, J = 7.8Hz, 1H), 4.05 - 3.60 (m, 1H, covered with H_2O in DMSO-d_6), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.83 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２１６）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



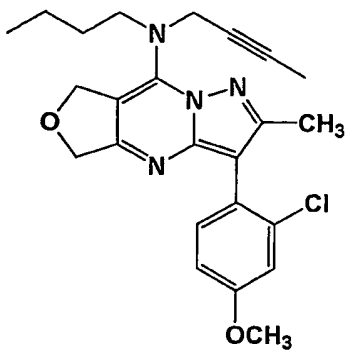
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88

(dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.39 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.68 - 1.54 (m, 2H), 1.39 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２１７）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

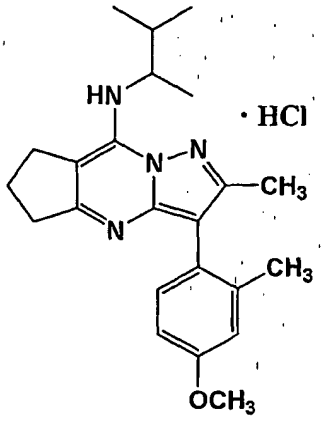


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.78（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.44 (q, J = 2.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.74 - 1.61 (m, 2H), 1.41 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２１８）

８－（３－メチル－２－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

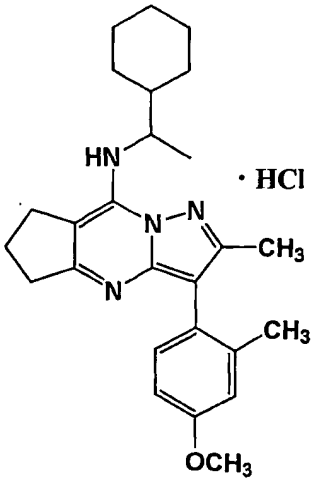


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.45 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.11 (dd J = 4.2, 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2 .28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.99 (m, 1H), 1.42 and 1.41 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.05 - 1.14 (m, 6H)。

実施例２（２１９）

８－（１－シクロヘキシルエチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

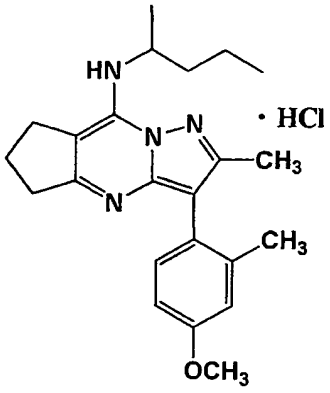


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.42 (brd, J = 10.5Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.1Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.28 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.18 (s, total 3H), 1.52 - 1.95 (m, 6H), 1.41 and 1.40 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 - 1.37 (m, 5H)。

実施例２（２２０）

８－（２－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

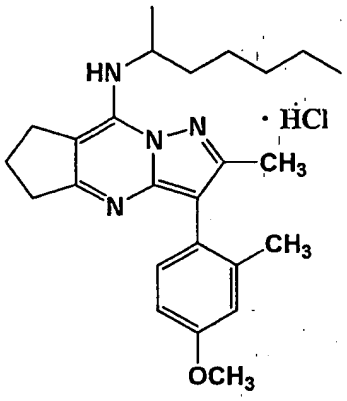


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (brd, J = 9.6Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.25 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.16 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.70 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.58 (m, 2H), 1.47 and 1.46 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 (m, 3H)。

実施例２（２２１）

８－（２－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

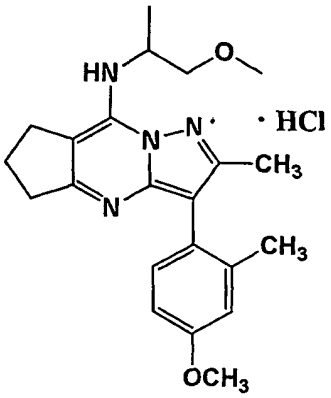


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.43（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.4Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J= 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.71 - 1.81 (m, 2H), 1.30 - 1.55 (m, 9H), 0.92 (m, 3H)。

実施例２（２２２）

８－（１－メトキシ－２－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

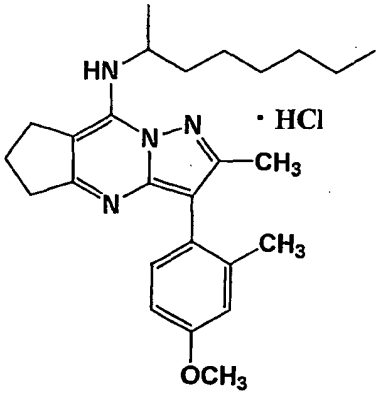


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.66 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.46 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.64 (dd, J = 3.9, 9.9Hz, 1H), 3.42 - 3.58 (m, 3H), 3.46 and 3.45 (s, total 3H), 3.23 (m, 1H), 3.11 (m, 1H), 2.29 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.19 and 2.18 (s, total, 3H), 1.49 (d, J = 6.6Hz, 3H)。

実施例２（２２３）

８－（２－オクチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

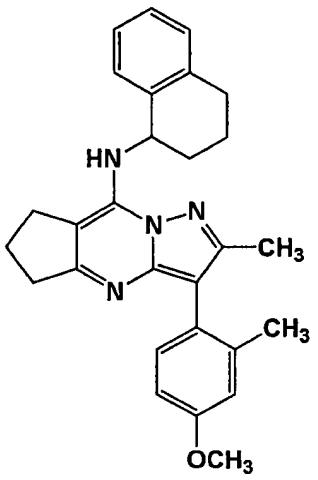


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.33 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.1Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.23 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (brt, J = 7.2Hz, 2H), 3.15 (t, J = 6.6H z, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.75 (m, 2H), 1.46 and 1.45 (d, J = 6.3Hz, total 3H), 1.26 - 1.45 (m, 8H), 0.90 (m, 3H)。

実施例２（２２４）

８－（１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

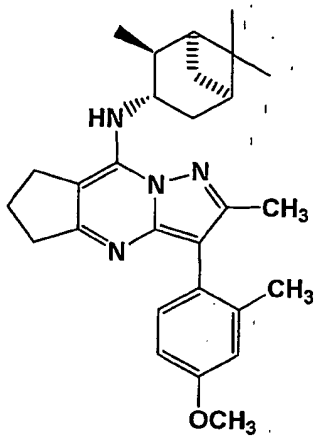


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.16（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.44 (m, 1H), 7.27 - 7.14 (m, 4H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.69 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 5.22 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.24 - 3.08 (m, 2H), 3.00 - 2.76 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 2.24 - 1.82 (m, 6H), 2.20 (s, 3H)。

実施例２（２２５）

8－（（1S，2S，3S，5R）－2，6，6－トリメチルビシクロ［3．1．1］－3－ヘプチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

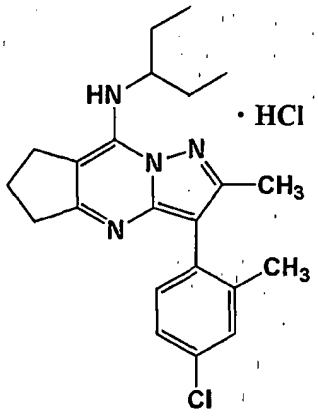


TLC：Rf 0.25（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.35 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 4.31 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.22 - 3.06 (m, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.62 - 2.46 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.19 - 1.82 (m, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.20 (d, J = 6.0Hz, 3H), 1.11 - 1.08 (m, 1H), 1.09 (s, 3H)。

実施例2（226）

8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－クロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

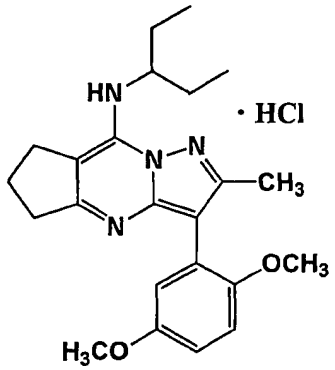


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.26 - 7.10 (m, 2H), 4.04 - 3.90 (m, 1H), 3.60 - 3.30 (m, 2H), 3.13 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (quint, J = 6.6Hz, 2H), 1.92 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２２７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，５－ジメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



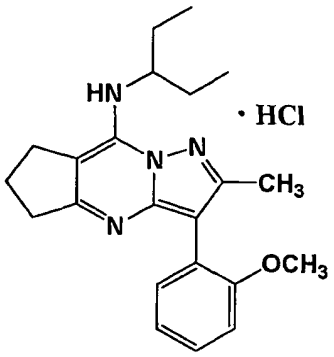
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 - 7.24 (m, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 2H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 4.05 - 3.95 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.8Hz, 2H),

3.12 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.29 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２２８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

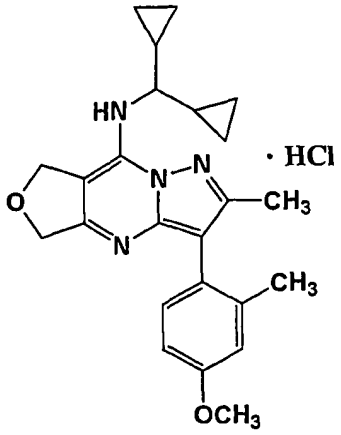


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.24（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.41 (t, J = 8.1Hz, 1H), 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.10 - 7.02 (m, 2H), 4.03 - 3.90 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.36 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２２９）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

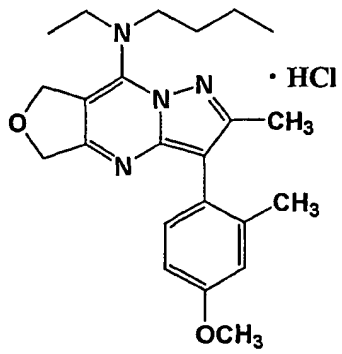


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.87 (m, 1H), 7.11 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.19 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.90 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.26 (m, 2H), 0.66 - 0.85 (m, 4H), 0.47 (m, 4H)。

実施例２（２３０）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



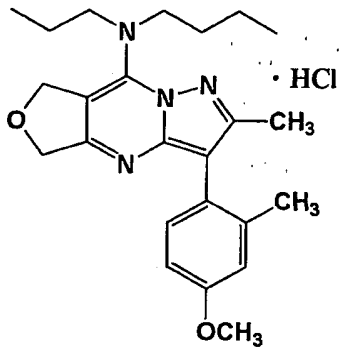
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

(dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.40 (s, 2H) ,5.23 (s, 2H), 3.85 - 4.00 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 2H), 1.46 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.44 (m, 2H), 1.02 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（２３１）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

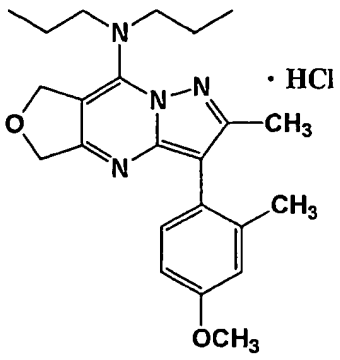


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.87 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 4H), 1.42 (m, 2H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２３２）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

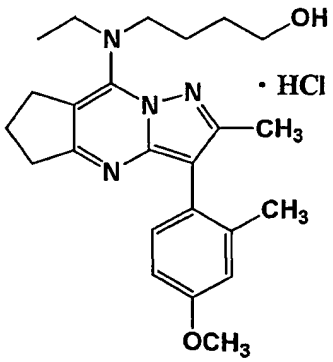


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 5.39 (brs, 2H), 5.21 (brs, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２３３）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－ヒドロキシブチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



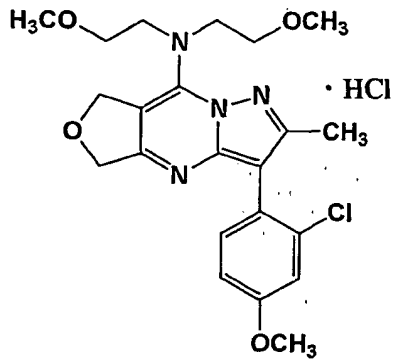
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 3.87 - 4.01 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.38 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.06 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2 .27 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s,

3H), 1.86 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 1.38 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２３４）

８－ビス（２－メトキシエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

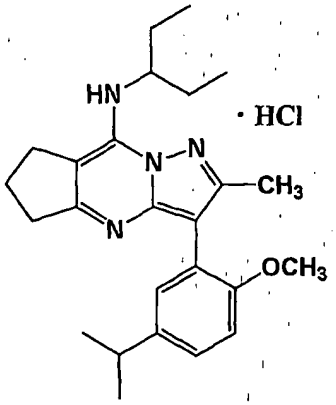


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.40 (m, 1H), 5.33 (m, 1H), 5.25 (m, 2H), 4.15 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (t, J = 5.1Hz, 4H), 3.35 (s, 6H), 2.35 (s, 3H)。

実施例２（２３５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－５－イソプロピルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

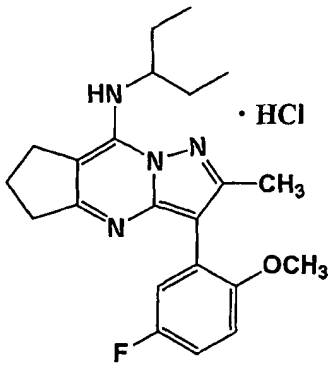


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.23 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 7.12 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.4Hz, 1H), 4.00 - 3.85 (m) and 3.91 (s) total 4H, 3.58 - 3.30 (m, 2H), 3.11 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.35 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.50 (m, 4H), 1.26 (d, J = 6.9Hz, 6H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２３６）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－５－フルオロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



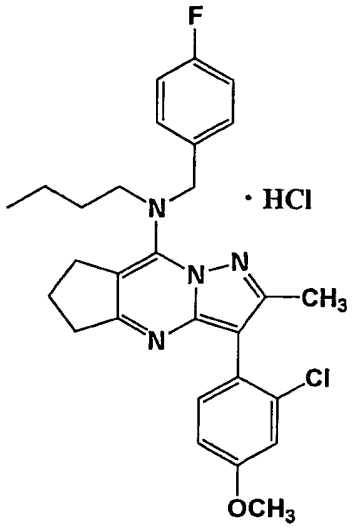
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.20 - 6.95 (m, 4H), 4.04 - 3.80 (m) and 3.91 (s) total

4H, 3.52 - 3.40 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.27 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２３７）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－５－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

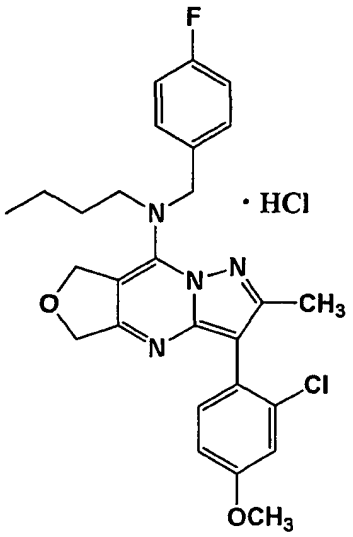


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.44 - 7.20 (m, 3H), 7.14 - 6.90 (m, 4H), 5.03 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 3.29 (m, 2H), 2.96 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.65 (m, 2H), 1.32 (m, 2H), 0.90 (m, 3H)。

実施例２（２３８）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

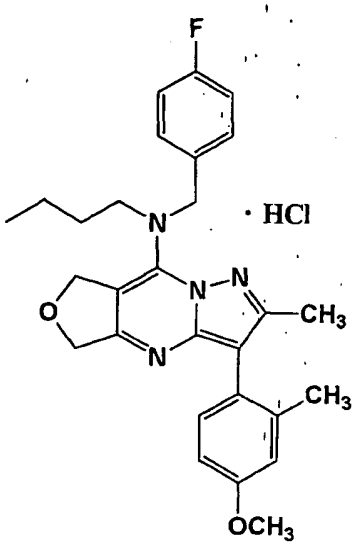


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.40 - 7.26 (m, 3H), 7.12 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.40 (m, 2H), 5.30 - 5.08 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.76 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0 .94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２３９）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

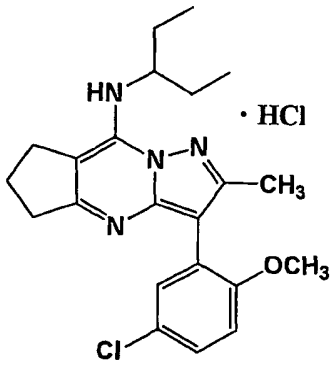


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.28（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (m, 2H), 7.18 - 7.04 (m, 3H), 6.89 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.85 - 6.78 (m, 1H), 5.23 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.58 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.71 (m, 2H), 1.35 (m , 2H), 0.95 - 0.84 (m, 3H)。

実施例２（２４０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－５－クロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

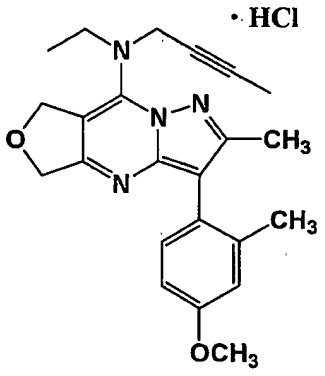


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (dd, J = 9.0, 3.0Hz, 1H), 7.25 - 7.05 (m) and 7.22 (d, J = 3.0Hz) total 2H, 6.98 (d, J = 9.0Hz, 1H), 4.03 - 3.85 (m) and 3.93 (s) total 4H, 3.55 - 3.40 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.28 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２４１）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

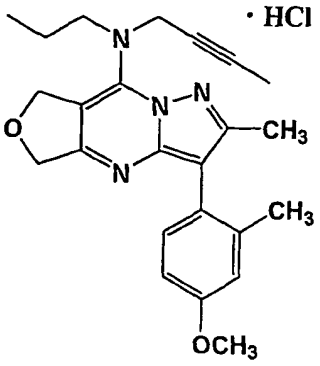


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 4H), 4.48 (m, 2H), 4.14 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.90 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.5 4 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２４２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

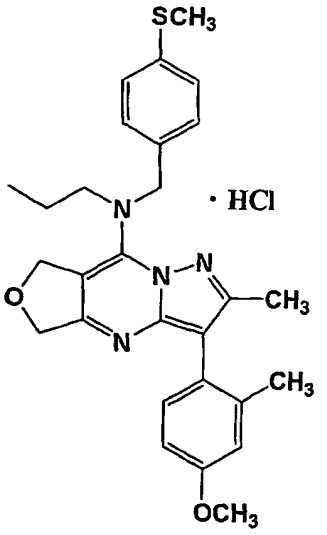


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.41 (m, 2H), 5.39 (m, 2H), 5.42 (m, 2H), 3.98 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1. 89 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２４３）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

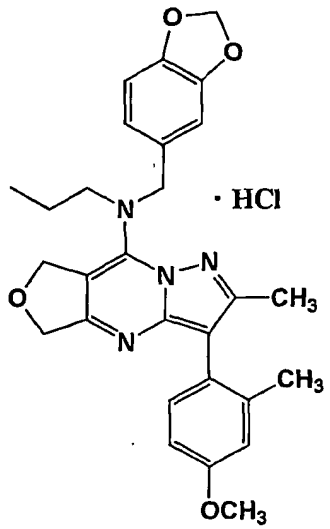


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.11 - 5.26 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.84 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２４４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

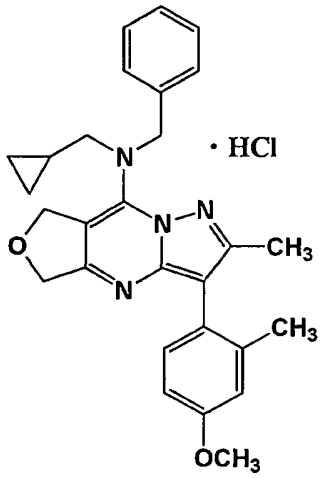


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.5Hz, 1H), 6.78 (d, J = 1.5Hz, 1H), 6.73 (dd, J = 1.5, 7.5Hz, 1H), 6.01 (s, 2H), 5.39 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.81 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２４５）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

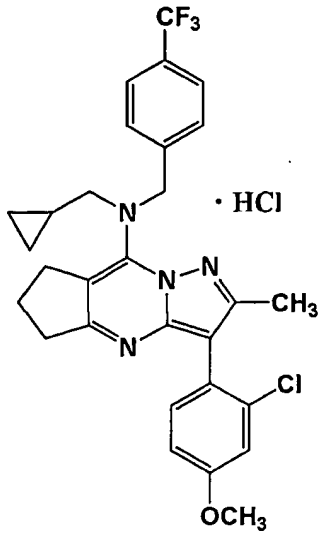


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 - 7.46 (m, 3H), 7.26 - 7.33 (m, 2H), 7.13 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 5.33 (m, 2H), 5.24 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.73 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m, 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例２（２４６）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－５－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

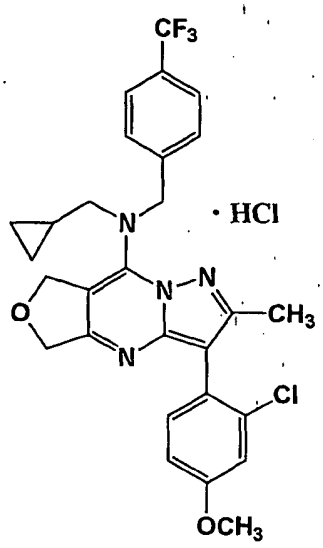


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.62 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.48 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.34 (brd, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.90 - 6.88 (m, 1H), 5.19 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 3.36 - 3.14 (m, 2H), 3.14 - 2.98 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 1.12 - 0.98 (m, 1H), 0.64 - 0.52 (m, 2H), 0.18 - 0.08 (m, 2H)。

実施例２（２４７）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

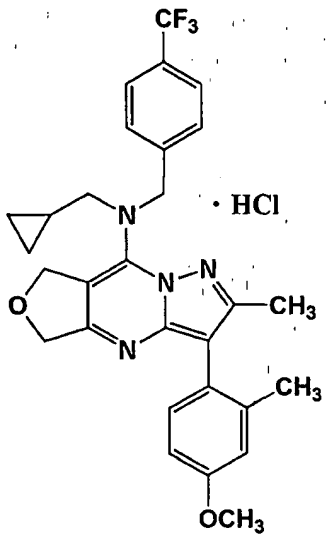


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.65 (brd, J = 7.5Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.5Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.35 - 5.18 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.54 (d, J = 6.6Hz, 2H) , 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.72 - 0.60 (m, 2H), 0.22 - 0.14 (m, 2H)。

実施例２（２４８）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

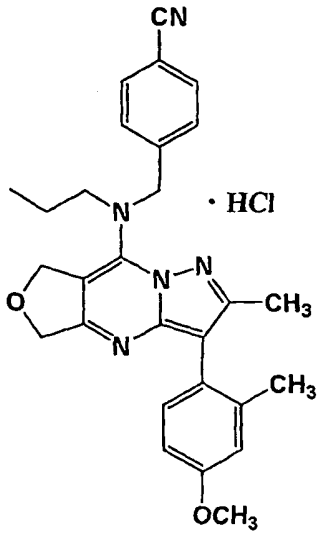


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.68 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.42 (m, 2H), 5.38 (s, 2H), 5.27 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.74 - 0.66 (m, 2H), 0.26 - 0.18 (m, 2H)。

実施例２（２４９）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

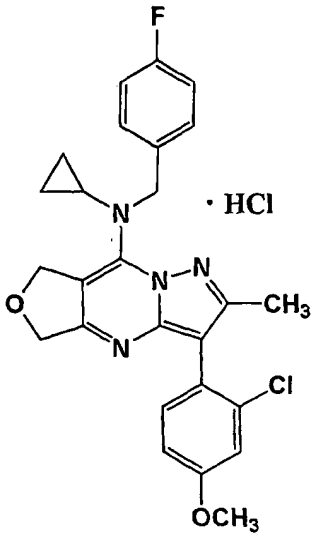


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.66 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.15 (brs, 2H), 5.09 (brs, 2H), 5.01 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.74 - 1.60 (m, 2H), 0.91 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（２５０）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

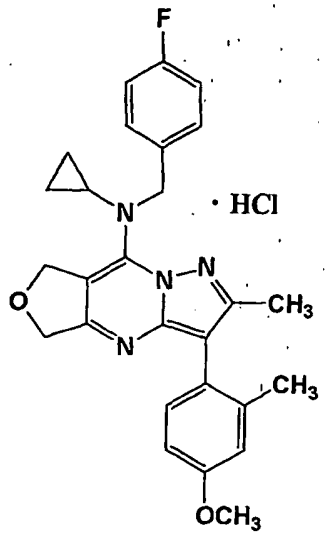


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 3H), 7.02 - 6.94 (m 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.18 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.89 - 0.79 (m, 4H)。

実施例２（２５１）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

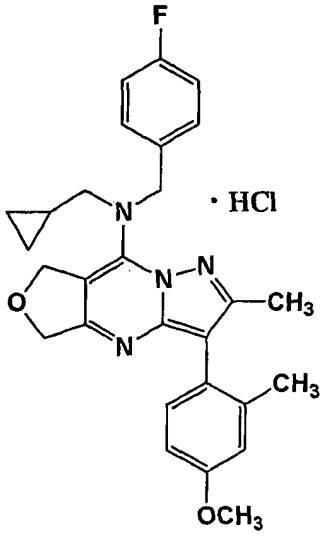


TLC：Rf 0.44（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.19 - 7.08 (m, 3H), 7.04 - 6.96 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.28 - 5.18 (m, 4H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.60 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.90 - 0.80 (m, 4H)。

実施例２（２５２）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

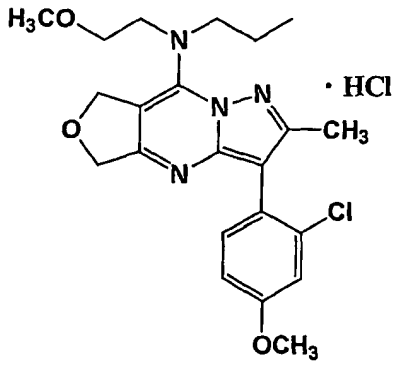


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.15 - 7.05 (m, 3H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.32 - 5.20 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.20 - 1.08 (m , 1H), 0.72 - 0.62 (m, 2H), 0.28 - 0.18 (m, 2H)。

実施例２（２５３）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

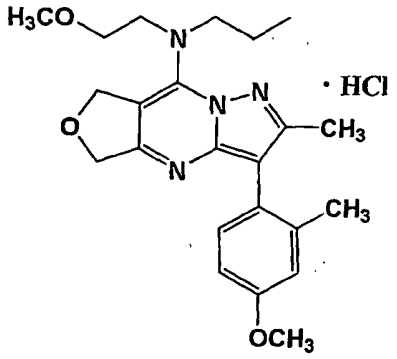


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.38 - 4.22 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 - 3.66 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２５４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



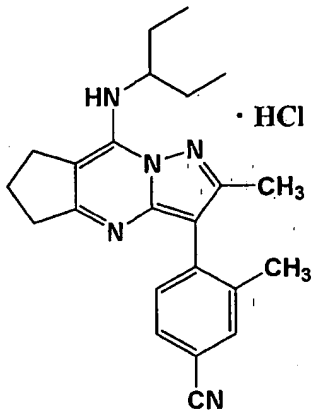
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H) 5.41 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.80 - 3.60 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２５５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－シアノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，

5－a］ピリミジン・塩酸塩

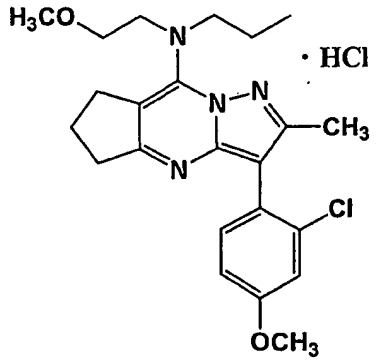


TLC：Rf 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.65 (s, 1H), 7.57 (d. J = 7.8Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.24 - 7.08 (m, 1H), 4.06 - 3.88 (m, 1H), 3.41 (brt, J = 7.2Hz, 2H), 3.15 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.30 (s) total 8H, 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例2（256）

8－（N－プロピル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

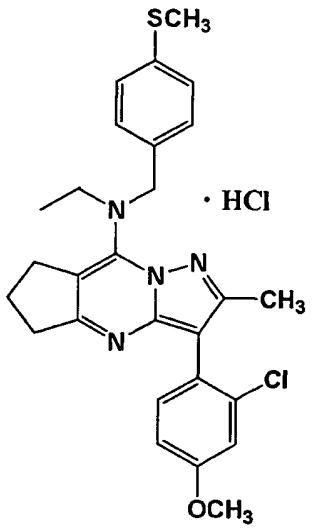


TLC：Rf 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.34 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.99 - 6.91 (m, 1H), 4.20 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.52 - 3.30 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.03 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２５７）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



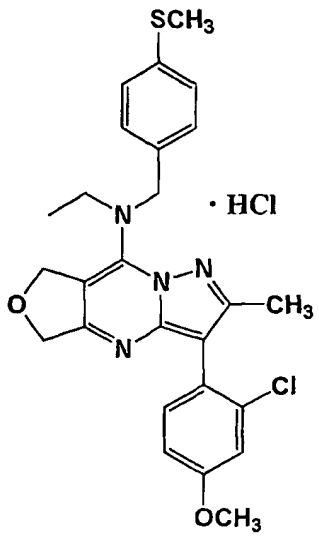
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.30 - 7.16 (m, 4H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 3.00 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.34 (m, 3H)。

実施例２（２５８）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－

フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

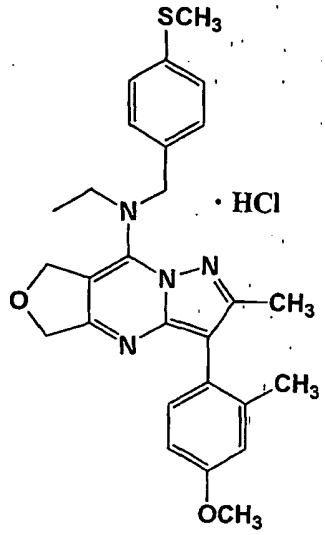


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.21 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.48 - 5.27 (m, 2H), 5.27 - 5.06 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.88 - 3.78 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.42 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（２５９）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

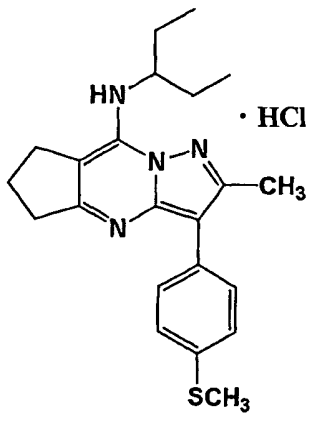


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (brd, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (brd, J = 8.4Hz, 2H),7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.40 (brs, 2H), 5.22 - 5.08 (m, 4H), 3.86 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.43 (t, J = 6.6Hz, 3H)。

実施例２（２６０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（４－メチルチオフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

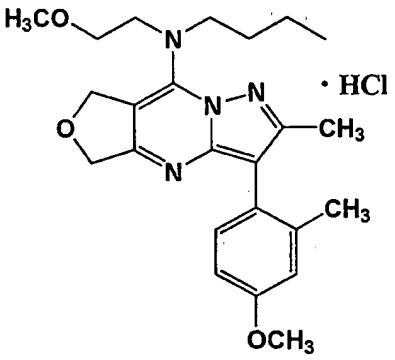


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.52 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.31 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.06 - 3.90 (m, 1H), 3.60 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 2.30 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２６１）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



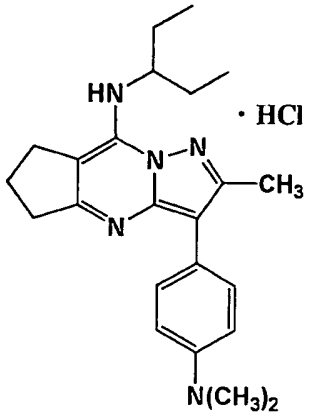
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.29 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.72 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 2.3 0 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.77 (quintet, J = 7.5Hz, 2H), 1.42 (sixtet, J = 7.5Hz, 2H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２６２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（４－ジメチルアミノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－

a］ピリミジン・塩酸塩

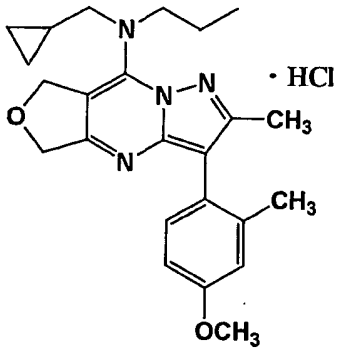


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.72 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.60 - 7.40 (m, 2H), 6.88 - 6.75 (m, 1H), 3.98 - 3.85 (m, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 3.15 - 3.05 (m) and 3.13 (s) total 8H, 2.52 (s, 3H), 2.25 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２６３）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

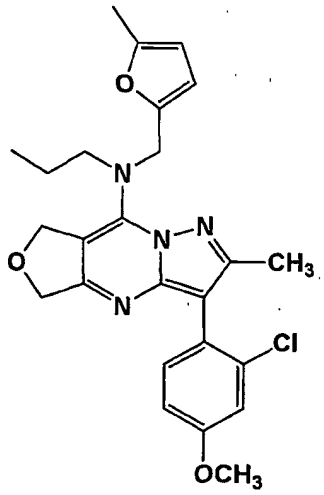


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.69 - 3.63 (m, 4H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.70 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.07 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.56 (m, 2H), 0.20 (m, 2H)。

実施例２（２６４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルフラン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



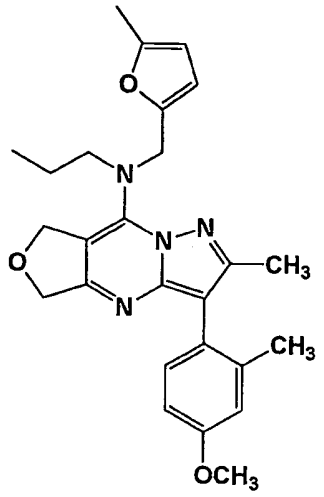
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.02 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.26 (m, 2H), 2. 41 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.66 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２６５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルフラン－２－イル）メチルアミノ）

－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

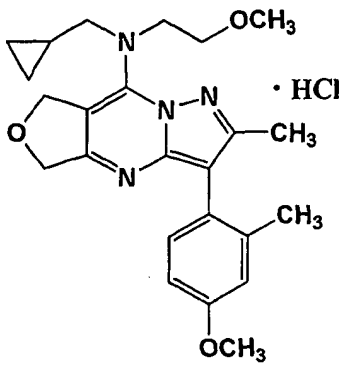


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (d, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 6.01 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.25 (m, 2H), 2.3 7 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.67 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２６６）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

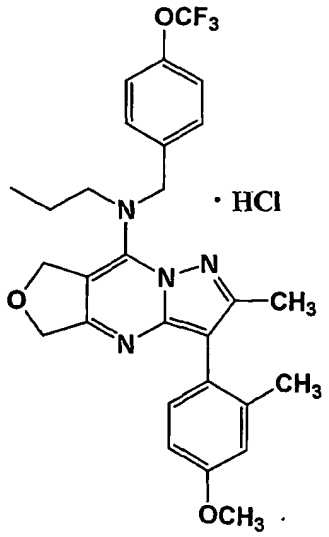


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.05 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.48 (d, J = 6.9 H z, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.04 (m, 1H), 0.56 (m, 2H), 0.22 (m, 2H)。

実施例２（２６７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

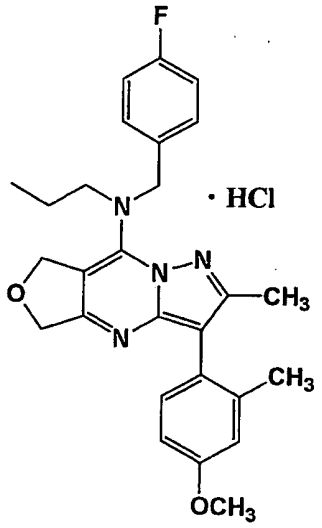


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.18 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.13 (brs, 2H), 4.97 (brs, 2H), 4.92 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（２６８）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

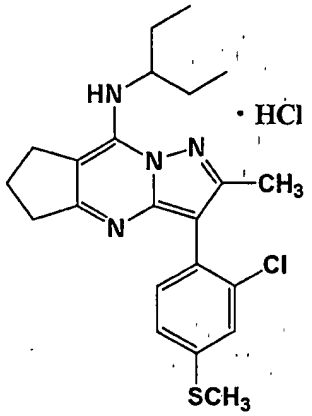


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 - 7.22 (m, 2H), 7.17 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 7.02 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.95 (brs, 4H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 0.90 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（２６９）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メチルチオフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

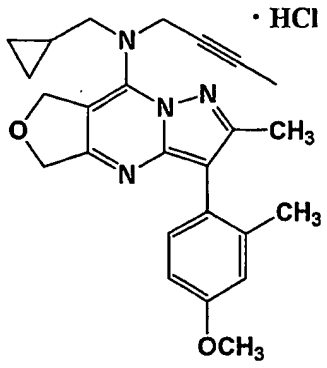


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.64（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.40 - 7.34 (m, 2H), 7.33 - 7.24 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 3.66 - 3.35 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.30 (m, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.10 - 1.00 (m, 6H)。

実施例２（２７０）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

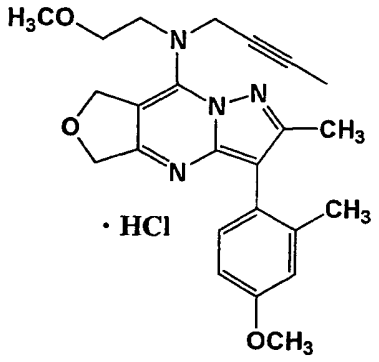


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.84 (s, 3H), 1.20 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

実施例２（２７１）

８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

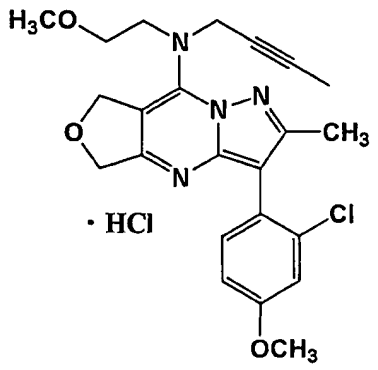


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.06 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.85 (s, 3H)。

実施例２（２７２）

８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

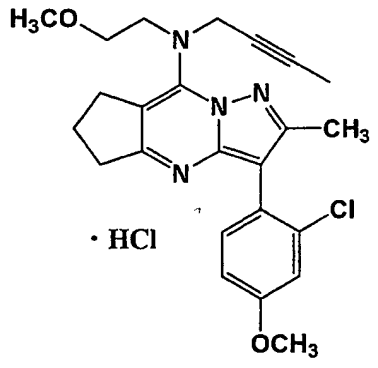


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.39（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.36 (m, 2H), 3.95 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.76 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.83 (s, 3H)。

実施例２（２７３）

８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



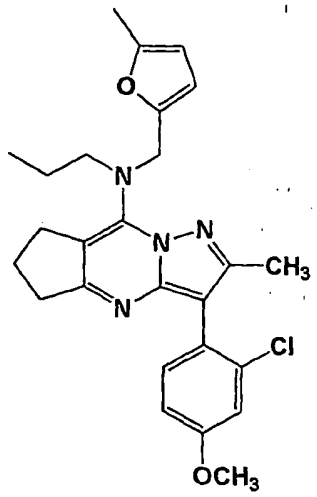
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.44（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.53 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.30 (m, 2H), 3.20 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J =

7.2Hz, 2H), 1.86 (t, J = 2.4Hz, 3H)。

実施例２（２７４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルフラン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

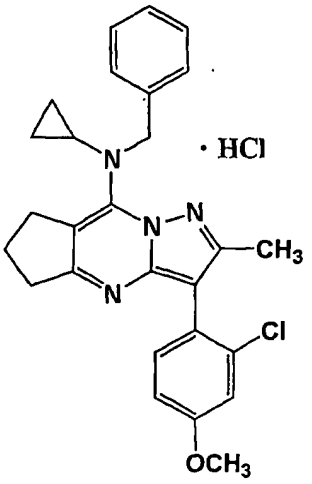


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.99 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.85 (dd, J = 1.6, 3.0Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.22 (m, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２７５）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

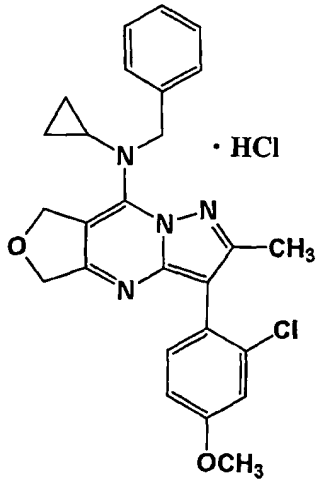


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.25 - 7.15 (m, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.00 - 6.94 (m, 1H), 5.39 (d, J = 14.7Hz, 1H), 5.27 (d, J = 14.7Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.70 - 3.32 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.96 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.20 - 0.92 (m, 4H)。

実施例２（２７６）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

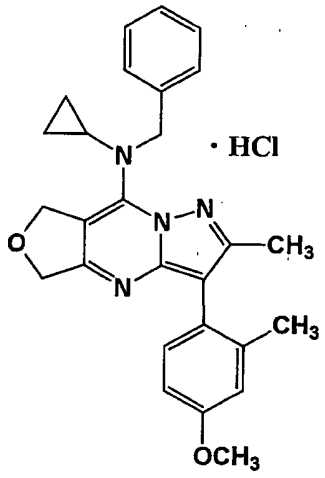


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 3H), 7.15 - 7.09 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 4H)。

実施例２（２７７）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

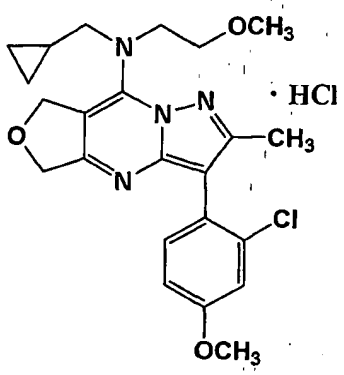


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.14 - 7.08 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.32 - 5.12 (m, 2H), 5.19 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 4H)。

実施例２（２７８）

8－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

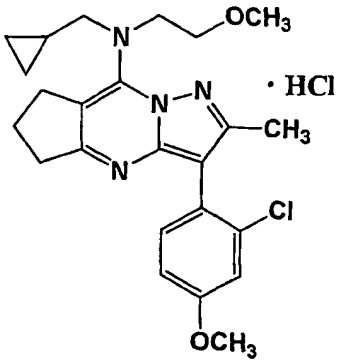


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.30 (m) and 5.27 (s) total 4H, 4.32 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.72 - 3.67 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.71 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

実施例２（２７９）

8－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

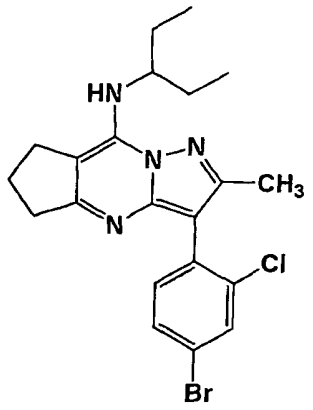


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.33（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.30 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.64 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.41 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.24 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.09 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.31 (m, 2H)。

実施例２（２８０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－ブロモフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



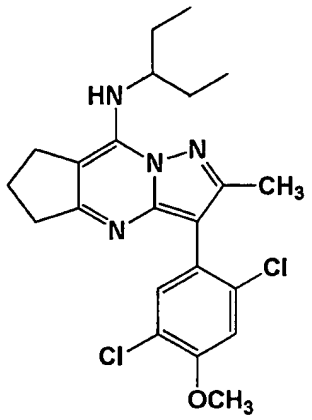
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.65 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 2.1, 8.1Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.23 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.81 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.1 5 (m, 2H), 1.60 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２８１）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，５－ジクロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾ

ロ［1，5－a］ピリミジン

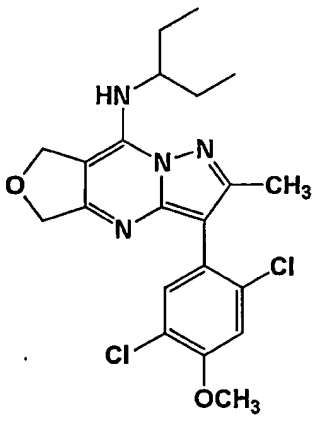


TLC：Rf 0.65（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.40 (s, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.22 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 1H), 2.33 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.58 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例2（282）

8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジクロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

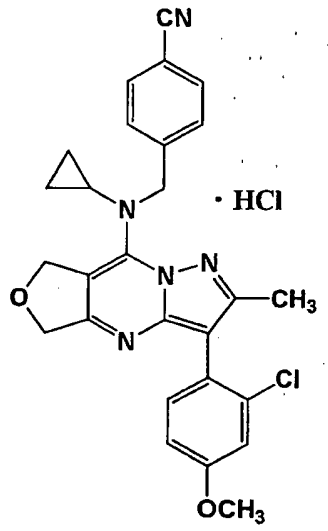


TLC：Rf 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.39 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.34 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 5.29 (m, 2H), 4.93 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.24 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 1.67 - 1.84 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（２８３）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

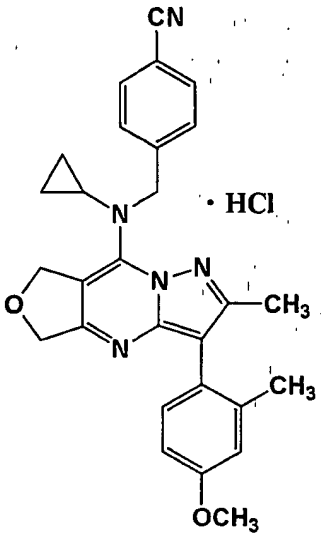


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 0.84 (m, 4H)。

実施例２（２８４）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

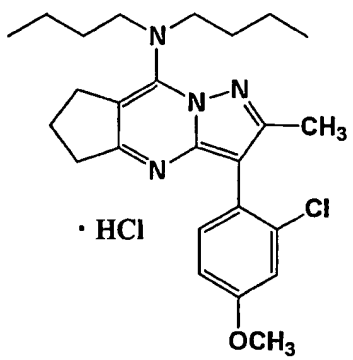


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.24（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.40 - 5.20 (m, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 0.84 (m, 4H)。

実施例２（２８５）

８－ジブチルアミノ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

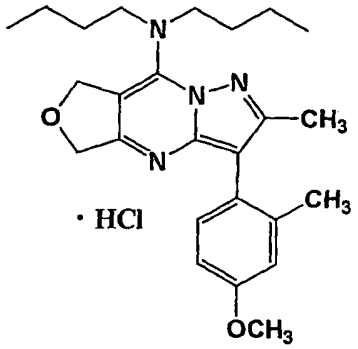


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.66（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 3.84 (s and m, total 7H), 3.35 (m, 2H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1. 67 (quint, J = 7.5Hz, 4H), 1.36 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 0.95 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２８６）

８－ジブチルアミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



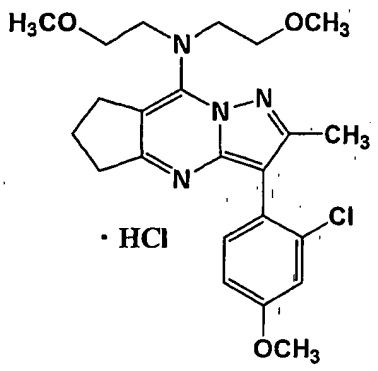
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.63（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.88 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.78 (quint, J = 7.5Hz, 4H), 1.42 (sixt, J = 7.5Hz, 4H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（２８７）

８－ビス（２－メトキシエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピ

ラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

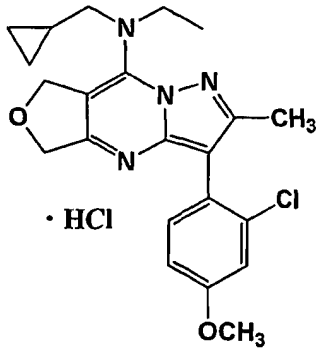


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 4.15 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (t, J = 5.4Hz, 4H), 3.53 (m, 1H), 3.45 (m, 1H), 3.31 (s, 6H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J = 7.2Hz, 2H)。

実施例２（２８８）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



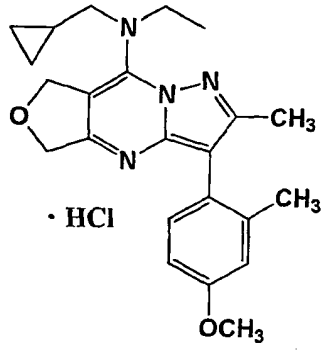
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.92

(m, 1H), 5.28 (s, 2H), 5.11 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.33 (s, 3H), 1.09 (m, 1H), 0.60 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例２（２８９）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

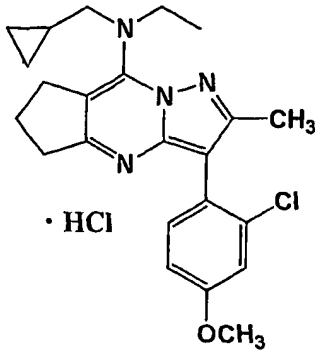


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.12 (m, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.82 (m, 1H), 5.38 (m, 2H), 5.31 (m, 2H), 3.99 (m, 2H), 3.83 (s and m, total 5H), 2.31(s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.44 (m, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.72 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

実施例２（２９０）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

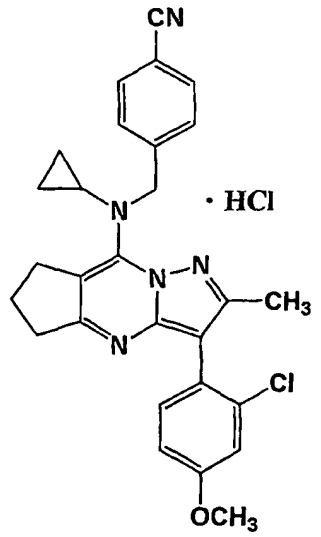


TLC：Rf 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J =8.4, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.59 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.04 (t, J = 7.5Hz, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.16 (q uint, J = 7.5Hz, 2H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.03 (m, 1H), 0.50 (m, 2H), 0.15 (m, 2H)。

実施例２（２９１）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

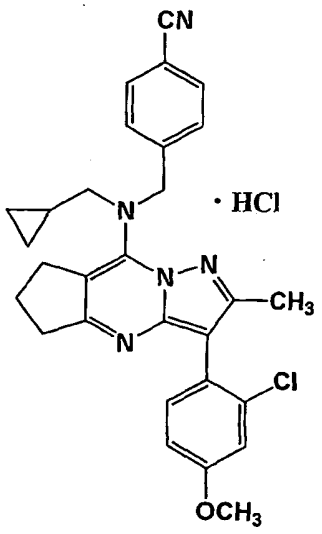


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.83 - 7.76 (m, 2H), 7.54 - 7.48 (m, 2H), 7.30 (dd, J = 8.7, 1.2Hz, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.02 - 6.96 (m, 1H), 5.12 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.06 (m, 2H), 2.94 - 2.78 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 0.79 - 0.70 (m, 2H), 0.61 (m, 2H)。

実施例２（２９２）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

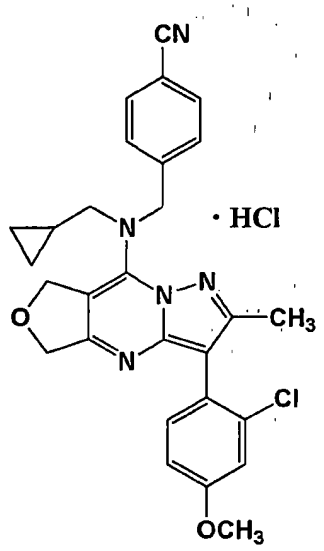


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.69 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 7.34 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.96 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.10 (m, 2H), 2.3 3 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.18 - 1.02 (m, 1H), 0.70 - 0.58 (m, 2H), 0.22 - 0.10 (m, 2H)。

実施例２（２９３）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

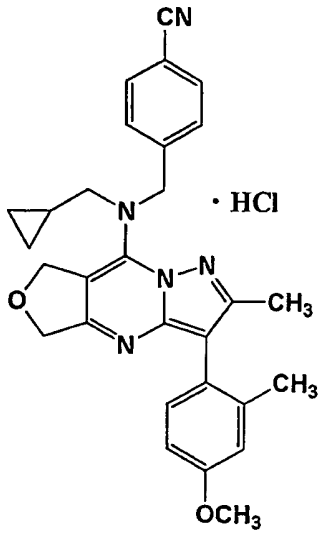


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.21（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.68 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.52 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.26 (m, 4H), 5.14 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.45 (d, J = 6.6 H z, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.68 - 0.56 (m, 2H), 0.18 - 0.10 (m, 2H)。

実施例２（２９４）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

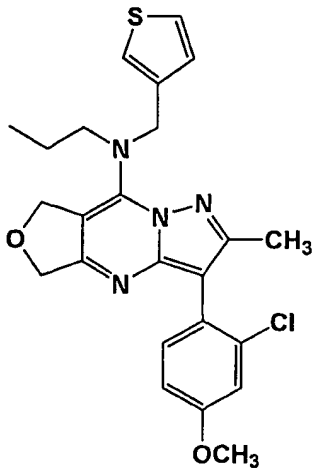


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.37（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.66 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.52 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.12 - 0.06 (m, 2H)。

実施例２（２９５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（チオフェン－３－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

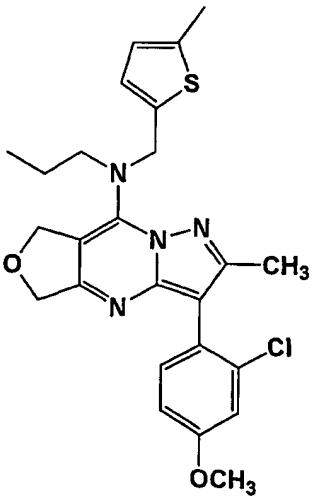


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.13 (m, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 0.9, 4.8Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.32 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２９６）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルチオフェン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

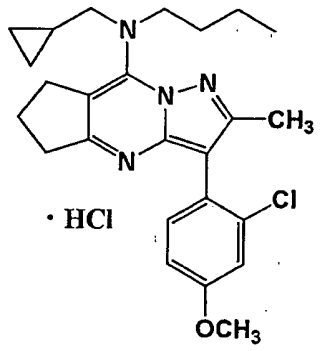


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 6.66 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.56 (m, 1H), 5.02 - 5.17 (m, 4H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（２９７）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



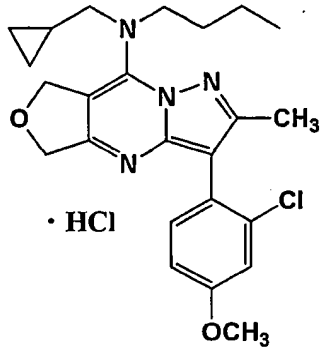
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.89 (dd, J =8.7, 2.1Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.69 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.56 (d, J = 7.2Hz, 2H), 3.02 (m, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7. 2Hz, 2H), 1.58 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.34 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.48 (m, 2H), 0.13 (m, 2H)。

実施例２（２９８）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－

（２－クロロー４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

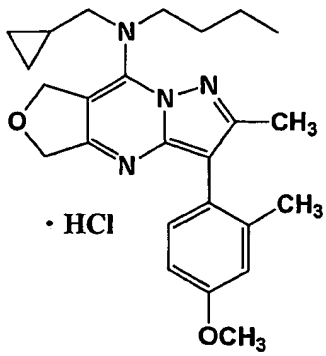


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.40（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.93 (dd, J =8.4, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.70 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.39 (sixt, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.62 (m, 2H), 0.25 (m, 2H)。

実施例２（２９９）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

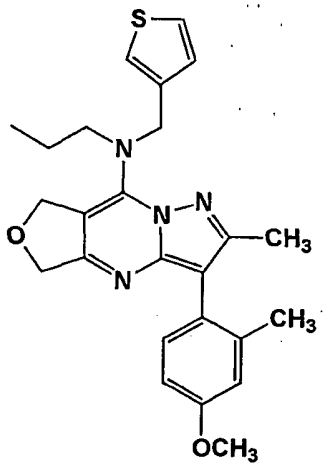


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.81 (dd, J =8.7, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.70 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.69 (m, 2H), 1 .39 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.09 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.60 (m, 2H), 0.23 (m, 2H)。

実施例２（３００）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（チオフェン－３－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



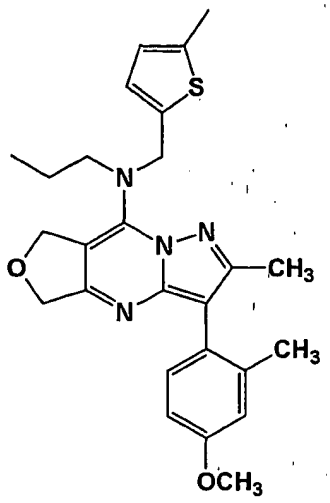
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (dd, J = 2.7, 5.1Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.13 (m, 1H), 6.97 (dd, J = 1.5, 5.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 3.0, 8.7Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.87 (s , 2H), 3.83 (s, 3H), 3.31 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３０１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルチオフェン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－

ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

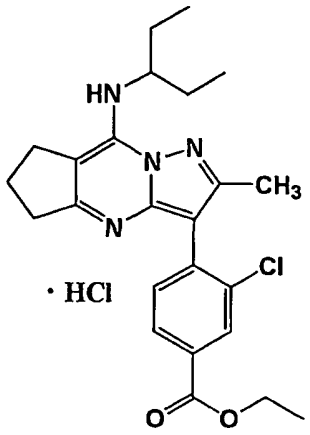


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 6.65 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 5.11 (s, 4H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2. 38 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３０２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－エトキシカルボニルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

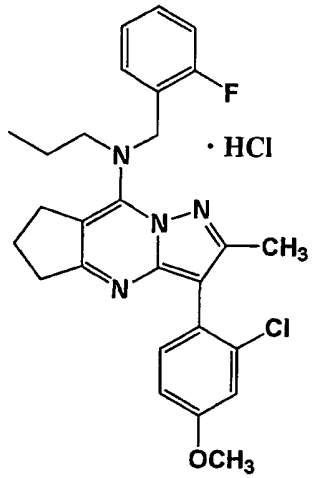


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.21 (d, J = 1.5Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 1.5, 7.8Hz, 1H), 7.56 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.30 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 4.38 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.00 (m, 1H), 3.34 - 3.64 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H) , 2.35 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 1.65 - 1.96 (m, 4H), 1.41 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３０３）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

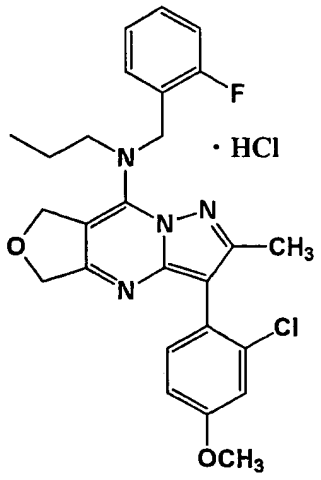


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.35 (m, 2H), 7.10 - 6.92 (m, 5H), 5.16 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.60 - 3.34 (m, 2H), 3.03 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 0.94 (m, 3H)。

実施例２（３０４）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



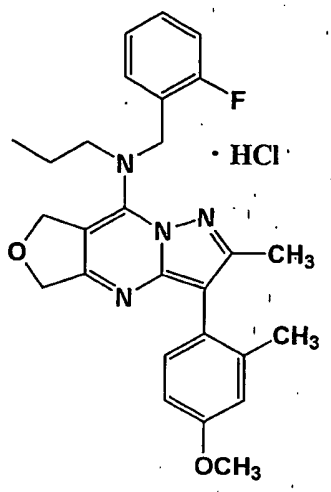
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.48 - 7.33 (m, 2H), 7.13 - 7.04 (m, 4H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.50 - 5.15 (m, 4H), 5.17 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.74 - 3.60 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.82 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３０５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－

フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン・塩酸塩

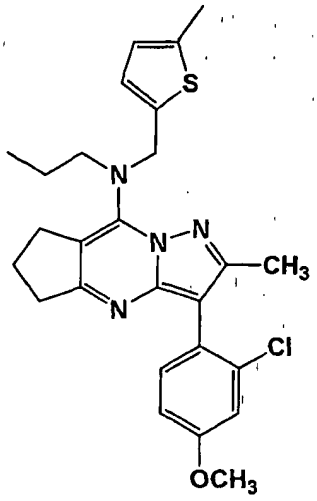


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.36 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.09 - 6.96 (m, 3H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 5.03 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.69 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.92 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３０６）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルチオフェン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

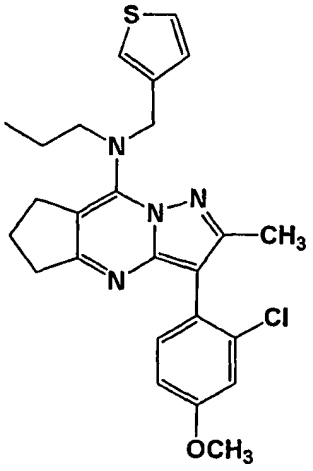


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.64 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.54 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.08 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３０７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（チオフェン－３－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

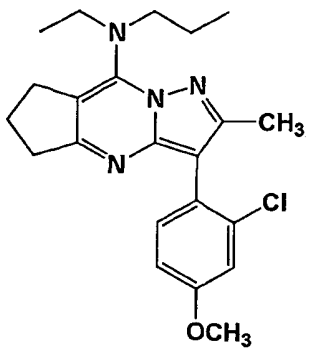


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 1.5, 5.1Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３０８）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



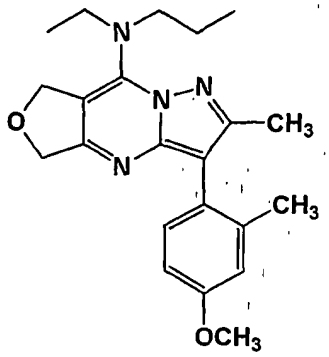
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.60 - 3.50 (m, 2H), 3.02 - 2.84 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.64 - 1.52 (m, 2H), 1.17 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.90 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（３０９）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾ

ロ［1，5－a］ピリミジン

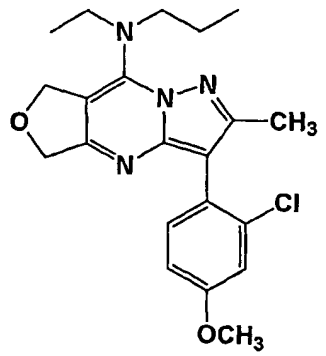


TLC：Rf 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例2（310）

8－（N－エチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン



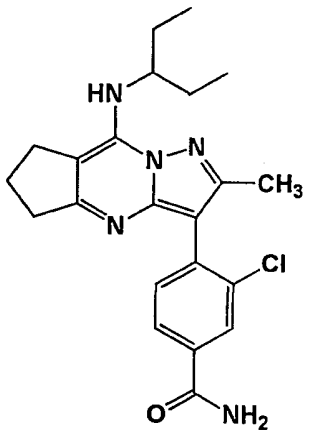
TLC：Rf 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89

(dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 1.24 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３１１）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－カルバモイルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

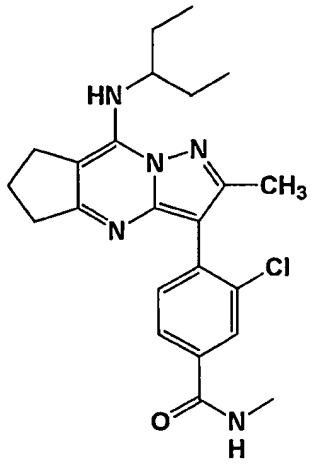


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（塩化メチレン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.96 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.1, 1.8Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.26 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 - 3.05 (m, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.22 - 2.10 (m , 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３１２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－（Ｎ－メチルカルバモイル）フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

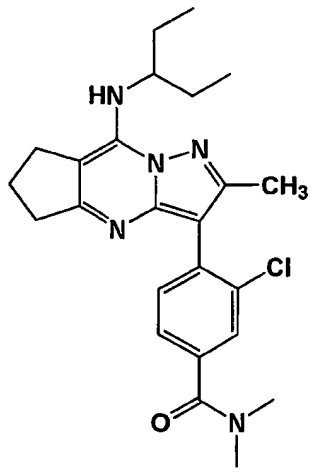


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（塩化メチレン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.89 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.8, 1.8Hz, 1H), 7.45 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.42 (brs, 1H), 6.26 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 - 3.05 (m, 2H), 3.01 (d, J = 4.5Hz, 3H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.22 - 2.09 (m, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３１３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルカルバモイル）フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

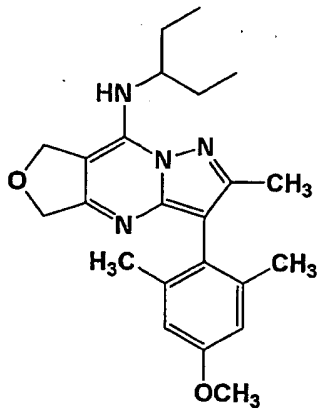


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.65（塩化メチレン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.56 (d, J = 1.5Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 1.5Hz, 1H), 6.26 (d, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.17 - 3.02 (m, 8H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.21 - 2.06 (m, 2H), 1.85 - 1.42 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３１４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



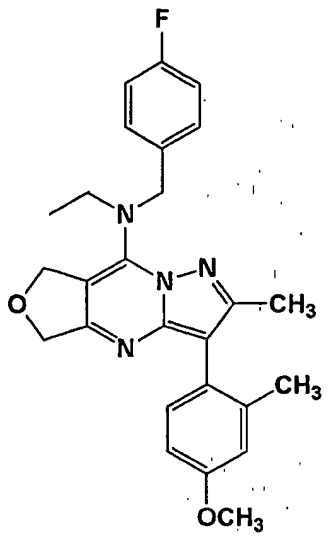
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.29（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.69 (s, 2H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.30 - 3.18 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.04 (s, 6H), 1.83 - 1.55 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３１５）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フ

ロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

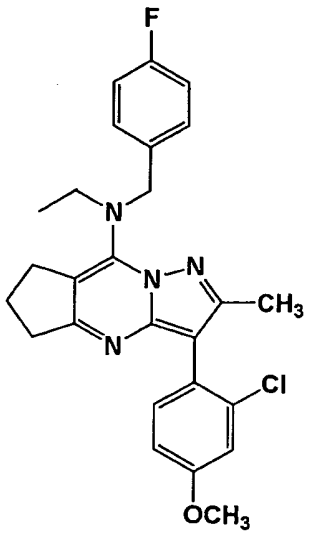


TLC：Rf 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 - 6.94 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.96 - 4.80 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例2（316）

8－（N－エチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

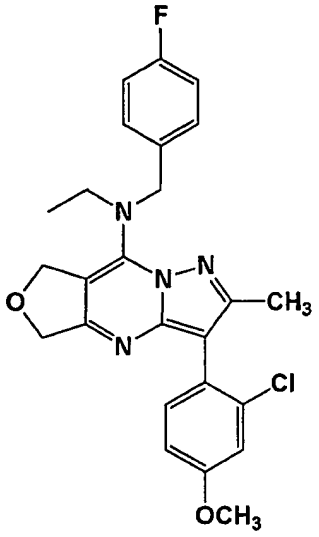


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.22 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.04 - 6.94 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.47 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.82 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.16 - 1.98 (m, 2H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３１７）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

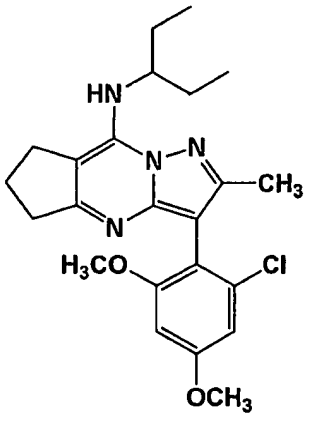


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.31 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.06 - 6.94 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.22 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３１８）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４，６－ジメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

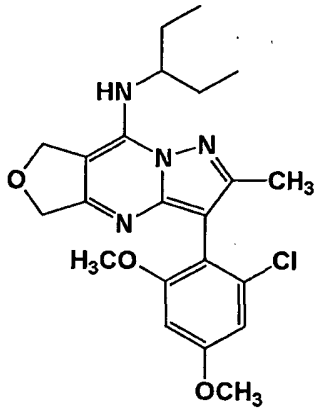


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.67 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.45 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.23 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.07 (m, 2H), 2.90 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.52 - 1.80 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３１９）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４，６－ジメトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



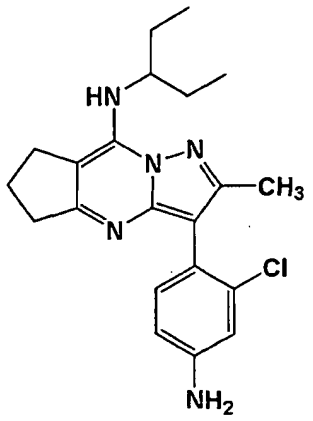
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 6.68 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.47 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.34 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 4.92 (d, J = 13.5Hz, 1H), 4.90 (d, J = 13.5Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 3.23 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.53 - 1.82 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３２０）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－アミノ

フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

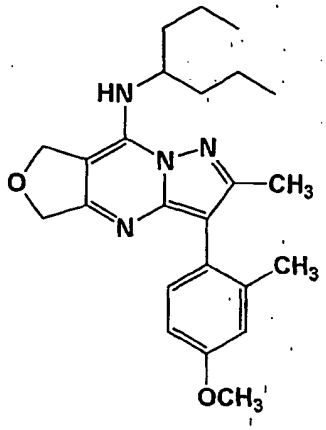


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.82 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.63 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.87 - 3.62 (m, 3H), 3.12 - 3.03 (m, 2H), 2.95 - 2.86 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.07 (m, 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３２１）

８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

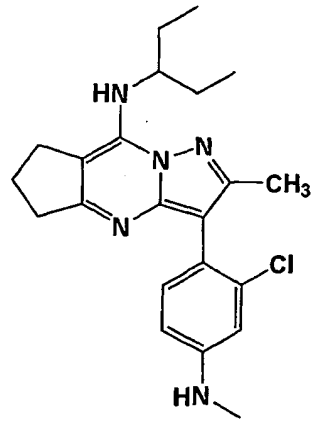


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.78 - 1.38 (m, 8H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３２２）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メチルアミノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

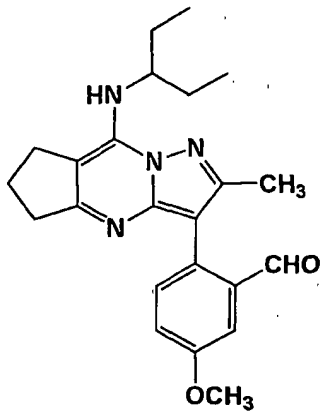


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.73 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.56 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.70 (m, 2H), 3.12 - 3.02 (m, 2H), 2.95 - 2.80 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３２３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－ホルミル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



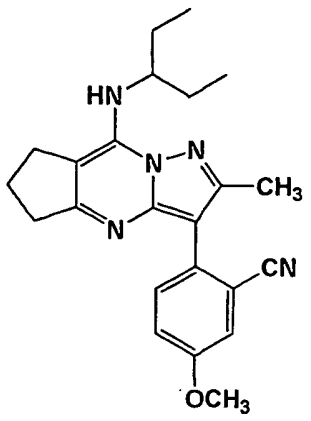
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 9.85 (s, 1H), 7.55 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.23 (d, J = 9.6Hz, 1H), 3.93 - 3.74 (m) and 3.89 (s) total 4H, 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３２４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－シアノ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，

５－ａ］ピリミジン

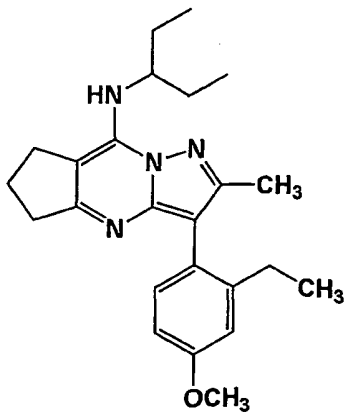


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.46 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 6.24 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.73 (m) and 3.86 (s) total 4H, 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３２５）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－エチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

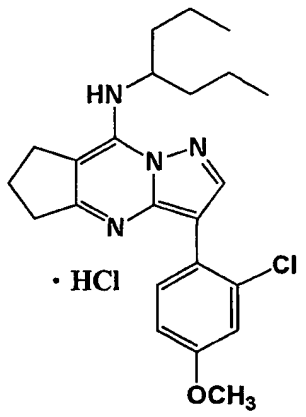


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m) and 3.83 (s) total 4H, 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.52 (q, J = 7.8Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.10 - 0.98 (m, 9H)。

実施例２（３２６）

８－（４－ヘプチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



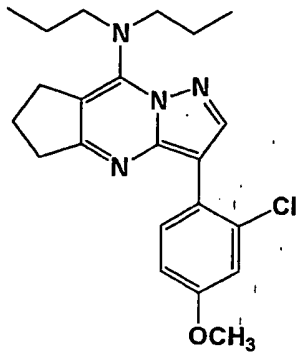
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.20 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.38 (d, J = 10.2Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 4.15 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 2.33 (m, 2H), 1.88 - 1.60 (m, 4H), 1.60 - 1.35 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３２７）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－

a］ピリミジン

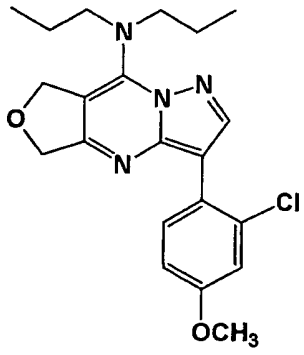


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.32 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.57 (m, 4H), 2.97 (m, 4H), 2.17 (m, 2H), 1.66 - 1.50 (m, 4H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３２８）

８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



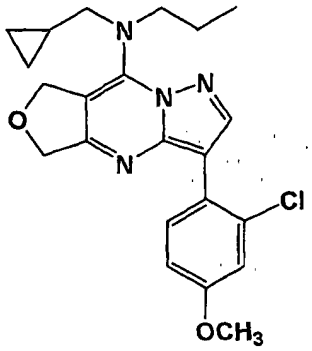
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.35 (s, 1H), 7.72 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.82 (s, 3H),

3.57 (t, J = 7.5Hz, 4H), 1.72 - 1.46 (m, 4H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例2（３２９）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－プロピルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

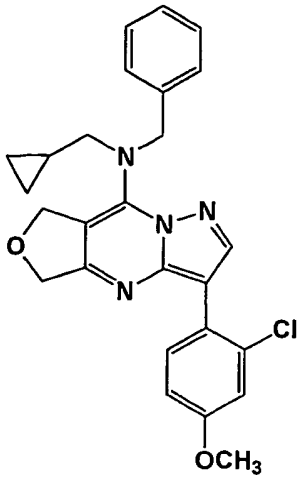


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.64 - 3.50 (m, 4H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.58 - 0.44 (m, 2H), 0.20 - 0.08 (m, 2H)。

実施例２（３３０）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

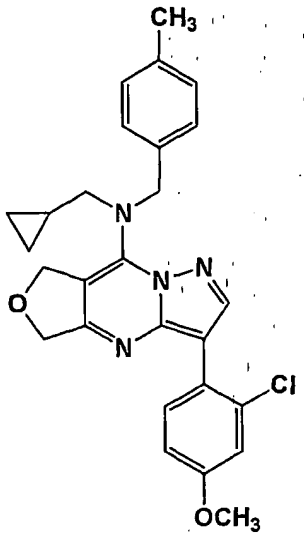


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.42 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.38 - 7.20 (m, 5H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.43 (d, J = 6.6Hz, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.58 - 0.46 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

実施例２（３３１）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

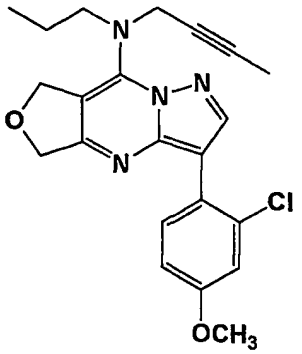


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.56（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.42 (s, 1H), 7.75 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.13 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 (d, J = 6.3Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.04 (m, 1H), 0.58 - 0.46 (m, 2H), 0.18 - 0.04 (m, 2H)。

実施例２（３３２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

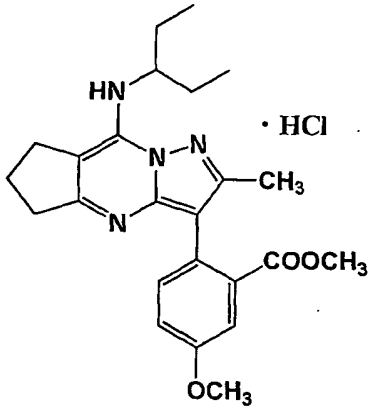


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.34 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.44 (q, J = 2.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.52 (m, 2H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.80 - 1.62 (m, 2H), 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３３３）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシカルボニル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



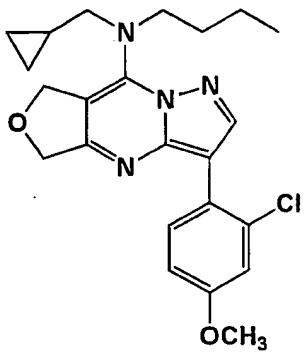
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.26（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.70 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.30 - 7.16 (m) and 7.19 (dd, J = 8.4, 2.7Hz) total 2H, 4.03 - 3.83 (m) and 3.89 (s) total 4H, 3.77 (s, 3H), 3.54 - 3.36 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.33 - 2.00 (m) and 2.25 (s) total 4H, 1.90 - 1.58 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３３４）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２－クロロ

－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

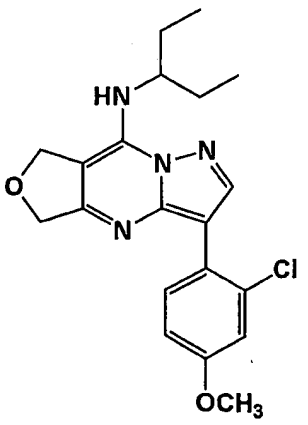


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.74 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.66 - 3.52 (m, 4H), 1.66 - 1.48 (m, 2H), 1.44 - 1.22 (m, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.60 - 0.44 (m, 2H), 0.22 - 0.08 (m, 2H)。

実施例２（３３５）

８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

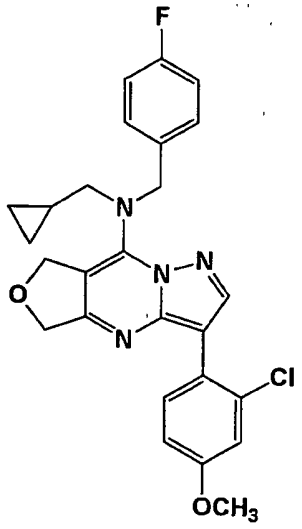


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.32 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.42 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.28 (m, 1H), 1.84 - 1.54 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３３６）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



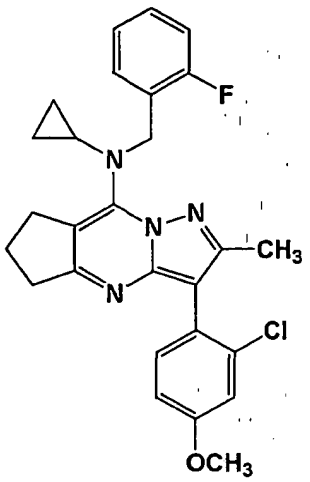
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.41 (s, 1H), 7.74 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.38 - 7.24 (m, 2H), 7.12 - 6.96 (m, 3H), 6.92 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.9Hz, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.44 (m, 2H), 0.16 - 0.02 (m, 2H)。

実施例２（３３７）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）

－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

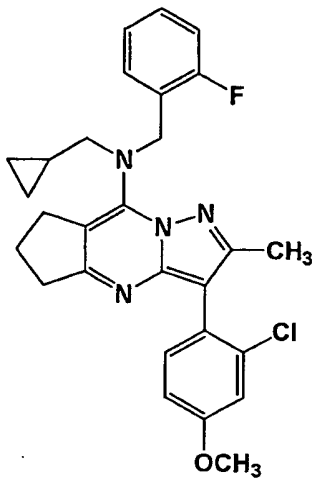


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（トルエン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.13 - 6.97 (m, 3H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.15 (brs, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.98 - 2.86 (m, 4H), 2.83 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 2. 02 (m, 2H), 0.84 - 0.72 (m, 4H)。

実施例２（３３８）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

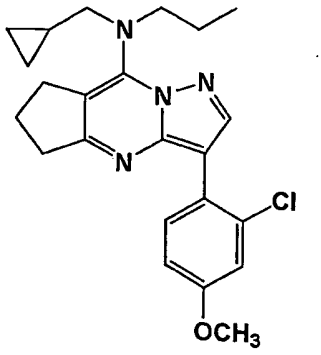


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（トルエン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.35 - 7.16 (m, 2H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.7Hz, 2.4Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.98 - 2.84 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.05 (m, 1H), 0.48 (m, 2H), 0.10 (m, 2H)。

実施例２（３３９）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－プロピルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

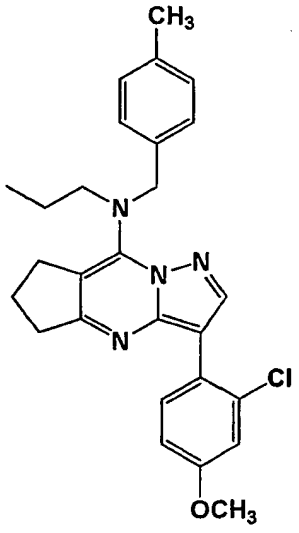


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.76（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.32 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.68 - 3.58 (m, 2H), 3.52 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.06 - 2.90 (m, 4H), 2.26 - 2.08 (m, 2H), 1.66 - 1.46 (m, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.52 - 0.42 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

実施例２（３４０）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



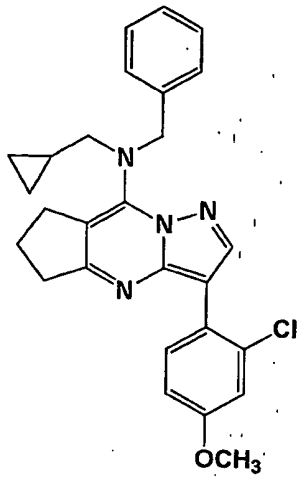
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.18 - 7.07 (m, 4H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 4.79 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.45 - 3.36 (m, 2H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.66 - 1.46 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３４１）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２－クロ

ロー４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

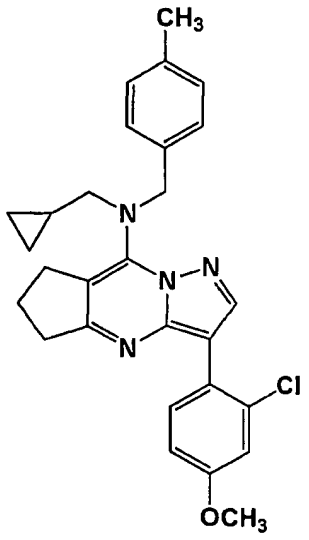


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.67（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.38 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.38 - 7.18 (m, 5H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.54 - 0.42 (m, 2H), 0.12 - 0.02 (m, 2H)。

実施例２（３４２）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

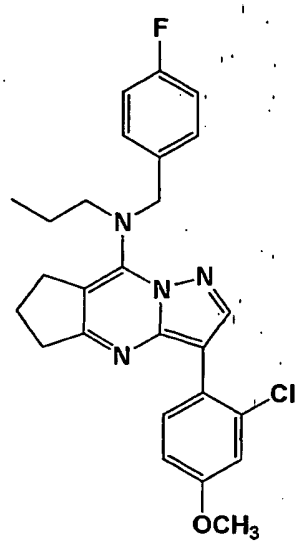


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.71（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.54 - 0.42 (m, 2H), 0.14 - 0.02 (m, 2H)。

実施例２（３４３）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

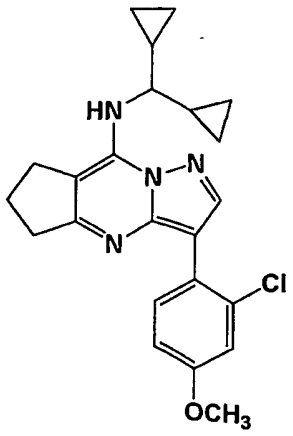


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.04 - 6.96 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.46 - 3.34 (m, 2H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.66 - 1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３４４）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

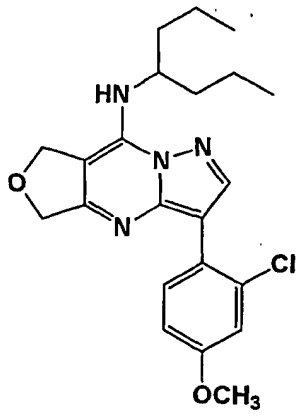


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.28 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.42 (d, J = 9.6Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.44 (m, 1H), 3.10 - 3.00 (m, 2H), 2.98 - 2.88 (m, 2H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.20 - 1.06 (m, 2H), 0.68 - 0.48 (m, 4H), 0.48 - 0.34 (m, 4H)。

実施例２（３４５）

８－（４－ヘプチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



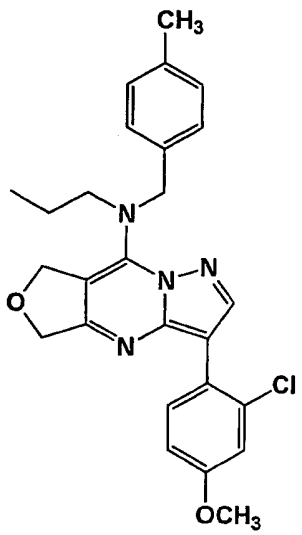
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.32 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.42 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 (m, 1H), 1.78 - 1.26 (m, 8H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３４６）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］

ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン

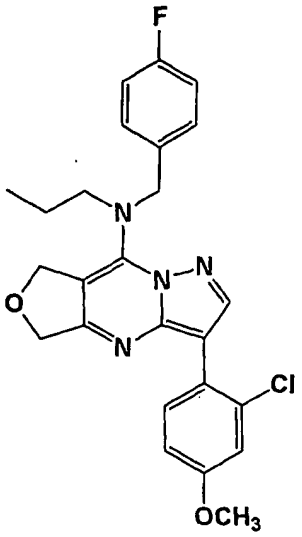


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.41 (s, 1H), 7.75 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.16 - 7.08 (m, 4H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 - 3.28 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.72 - 1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２（３４７）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

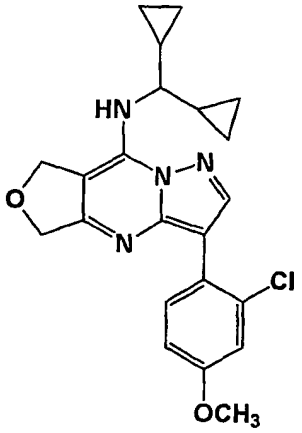


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.41 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.32 - 7.18 (m, 2H), 7.08 - 6.97 (m, 3H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.40 - 3.26 (m, 2H), 1.70 - 1.48 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３４８）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

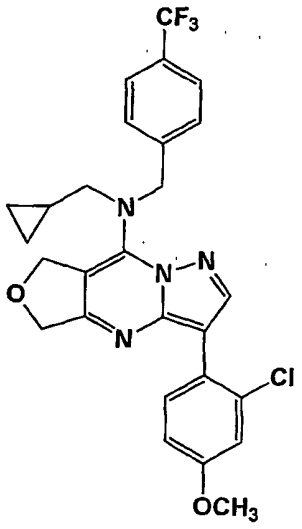


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.33 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.55 (d, J = 9.6Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.92 (m, 1H), 1.22 - 1.06 (m, 2H), 0.70 - 0.48 (m, 4H), 0.48 - 0.30 (m, 4H)。

実施例２（３４９）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

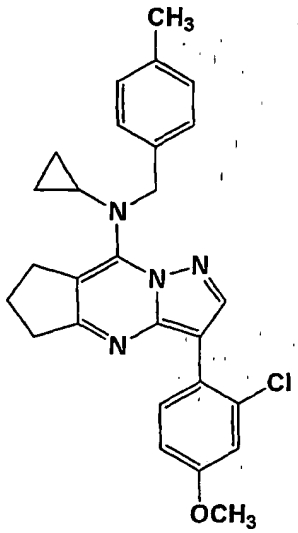


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.41 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.6Hz, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.46 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

実施例２（３５０）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

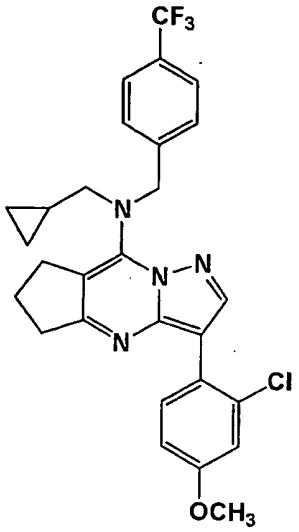


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.36 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.12 - 6.99 (m, 5H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.97 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.78 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.16 - 2.00 (m, 2H), 0.82 - 0.68 (m, 4H)。

実施例２（３５１）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

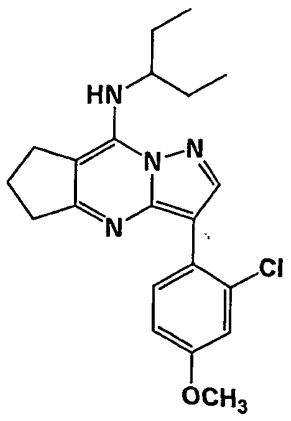


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.49 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.04 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.56-0.42 (m, 2H), 0.14-0.02 (m, 2H)。

実施例２（３５２）

８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

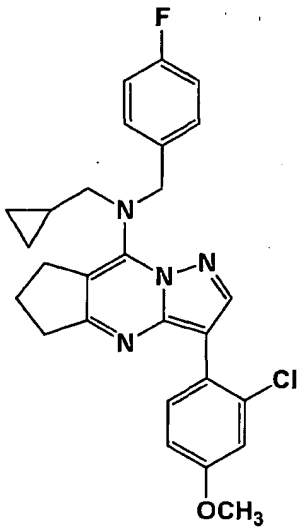


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.27 (s, 1H), 7.79 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.30 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.84-1.52 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３５３）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

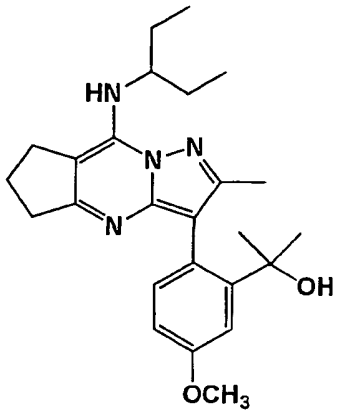


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.37 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.38-7.24 (m, 2H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.05-6.93 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.87 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.97 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-2.06 (m, 2H), 1.00 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.12-0.02 (m, 2H)。

実施例２（３５４）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－（１－メチル－１－ヒドロキシエチル）－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

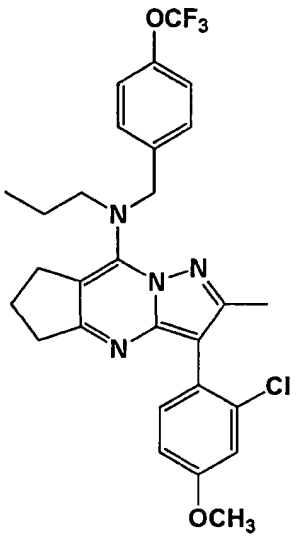


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.23 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.26 (d, J = 10.2Hz, 1H), 5.00-4.85 (m , 1H), 3.85-3.75 (m) and 3.84 (s) total 4H, 3.06 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.85 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.11 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.80-1.50 (m) and 1.64 (s) total 7H, 1.30 (s, 3H), 1.03 (t, J = 7.2Hz) and 1.00 (t, J = 7.2Hz) total 6H。

実施例２（３５５）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

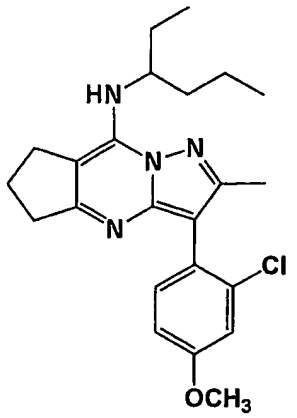


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.52（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.84 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.06-1.98 (m, 2H), 1.66-1.48 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３５６）

８－（３－ヘキシルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

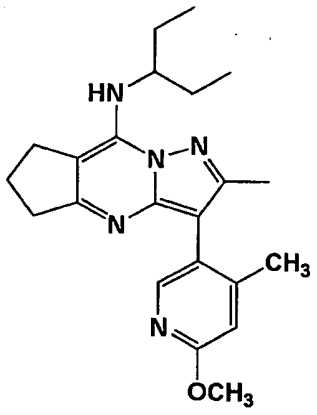


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.44（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 6.22 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.20-2.04 (m, 2H), 1.80-1.32 (m, 6H), 1.00 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.95 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

実施例２（３５７）

８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－４－メチルピリジン－５－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



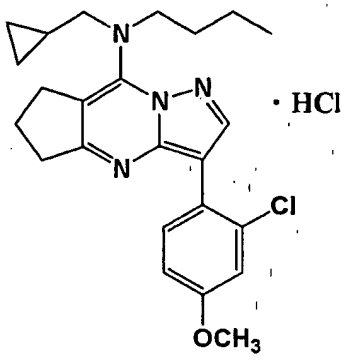
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.23（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.00 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20-2.06 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.82-1.54 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３５８）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］

ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

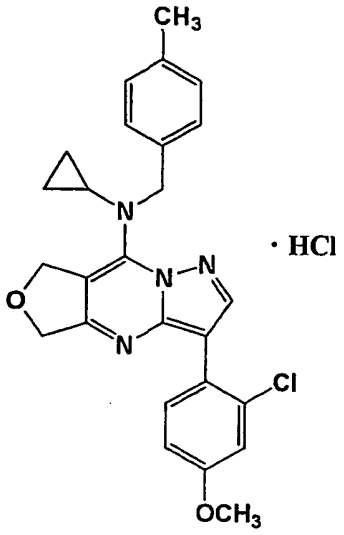


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.27 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.64 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.30-3.12 (m, 2H), 3.12-2.96 (m, 2H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.68-1.50 (m, 2H), 1.46-1.20 (m, 2H), 1.06 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.62-0.46 (m, 2H), 0.24-0.10 (m, 2H)。

実施例２（３５９）

８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

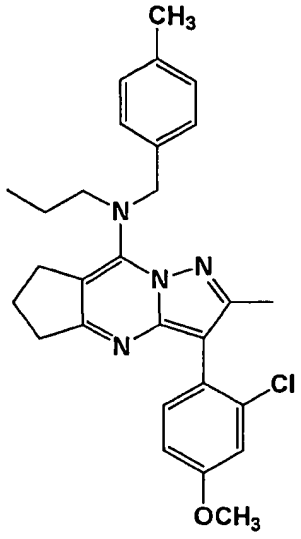


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.42 (s, 1H), 7.76 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.1Hz, 2H), 6.93 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 5.11 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 0.86-0.76 (m, 4H)。

実施例２（３６０）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

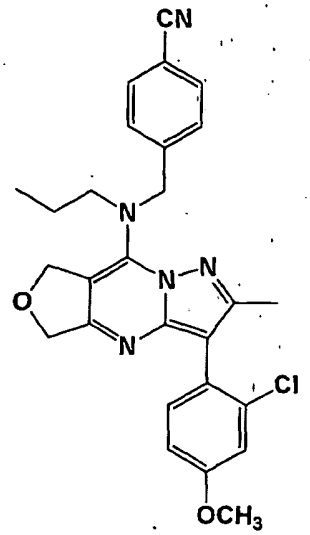


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.74（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.16-7.06 (m, 4H), 7.07 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 3.0Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42-3.30 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.82 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.04-1.98 (m, 2H), 1.70-1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３６１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

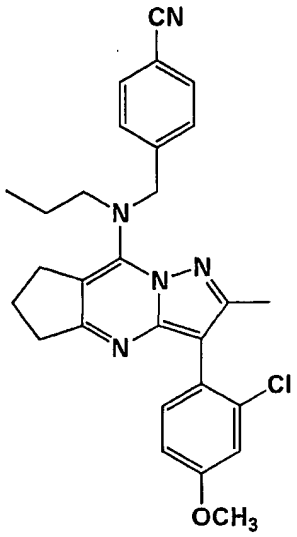


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.64 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 5.01 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36-3.22 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.70-1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３６２）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

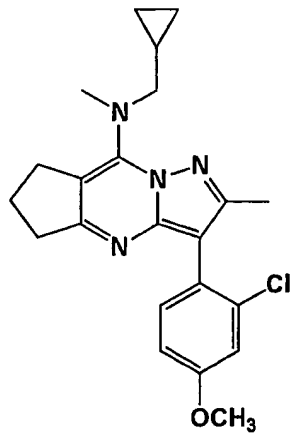


ＴＬＣ：Ｒｆ0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.47 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.20-2.02 (m, 2H), 1.66-1.46 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３６３）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

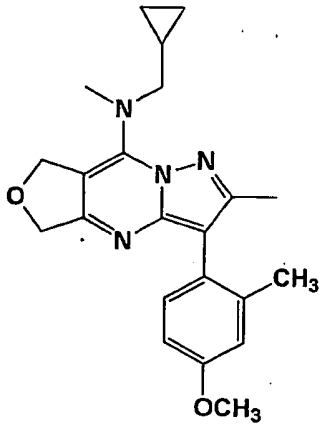


ＴＬＣ：Ｒｆ0.30（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 3.0Hz, 1H),6.88 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H),3.61 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.30 (s, 3H),3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H),2.36 (s, 3H), 2.20-2.06 (m, 2H),1.09 (m, 1H), 0.60-0.46 (m, 2H),0.24-0.12 (m, 2H)。

実施例２（３６４）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



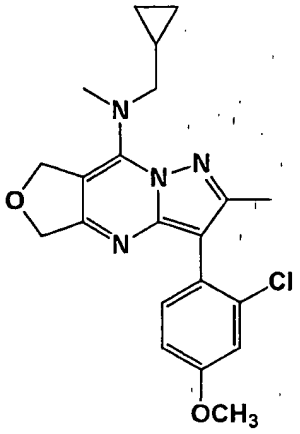
ＴＬＣ：Ｒｆ0.22（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H),6.80 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 5.35 (s, 2H),4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H),3.72 (dd, J = 6.9, 1.5Hz, 2H), 3.27 (s, 3H),2.34 (s, 3H), 2.15 (s, 3H),1.10 (m, 1H), 0.60-0.48 (m, 2H),0.24-0.14 (m, 2H)。

実施例２（３６５）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－メチルアミノ）－２－メチル－３－

（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

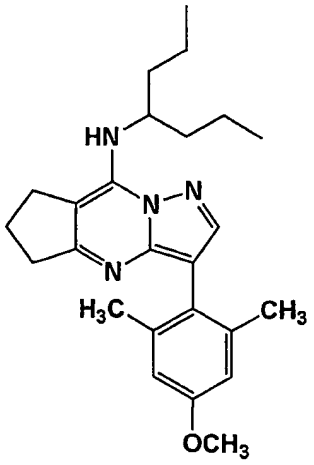


ＴＬＣ：Ｒｆ0.18（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H),6.88 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.35 (s, 2H),4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H),3.71 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.27 (s, 3H),2.38 (s, 3H), 1.10 (m, 1H),0.62-0.50 (m, 2H), 0.26-0.16 (m, 2H)。

実施例２（３６６）

８－（４－ヘプチルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

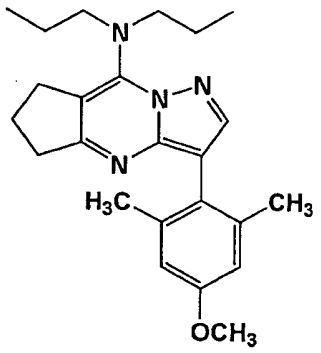


ＴＬＣ：Ｒｆ0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.80 (s, 1H), 6.83 (s, 2H), 6.27 (d, J = 11.1Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.76-1.30 (m, 8H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２（３６７）

８－ジプロピルアミノ－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

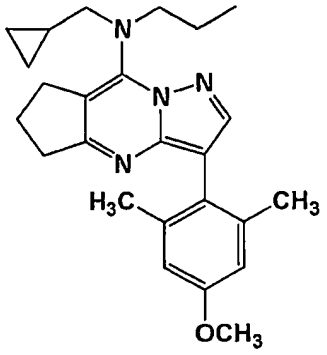


ＴＬＣ：Ｒｆ0.54（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.86 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.64-3.46 (m, 4H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.68-1.48 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例２（３６８）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－プロピルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

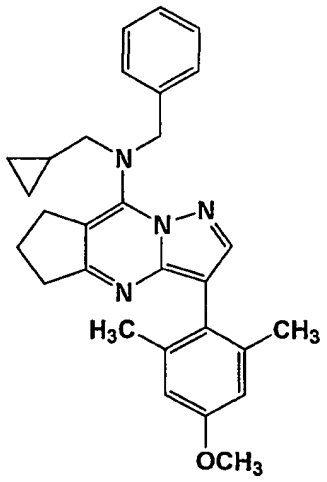


ＴＬＣ：Ｒｆ0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.86 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.54 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.03 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.04-2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.68-1.50 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.18-0.04 (m, 2H)。

実施例２（３６９）

８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

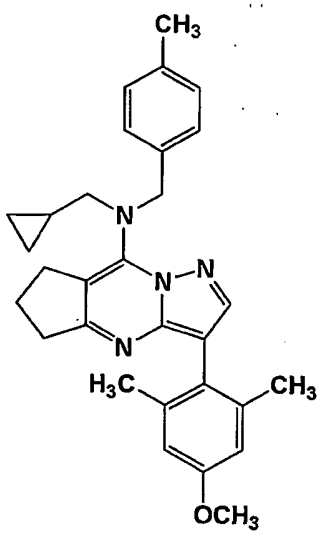


ＴＬＣ：Ｒｆ0.49（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.93 (s, 1H), 7.42-7.08 (m, 5H), 6.70 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.03 (m, 1H), 0.54-0.38 (m, 2H), 0.12-0.01 (m, 2H)。

実施例２（３７０）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



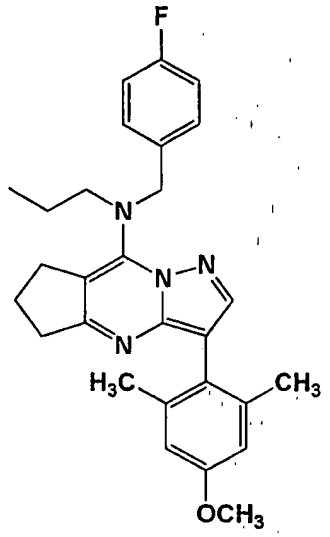
ＴＬＣ：Ｒｆ0.53（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.92 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.1Hz, 2H), 6.70 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.40 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22-2.04 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.03 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.10-0.01 (m, 2H)。

実施例２（３７１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ）－３－

（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

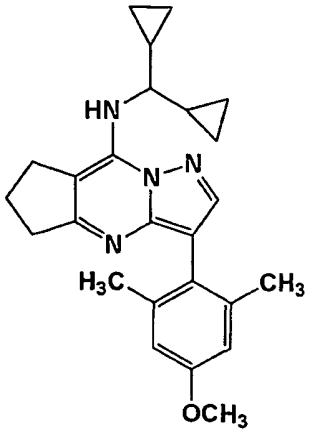


ＴＬＣ：Ｒｆ0.46（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.92 (s, 1H), 7.36-7.18 (m, 2H), 7.06-6.88 (m, 2H), 6.70 (s, 2H), 4.80 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.46-3.32 (m, 2H), 3.00-2.80 (m, 4H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.70-1.48 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例２（３７２）

８－ジシクロプロピルメチルアミノ－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

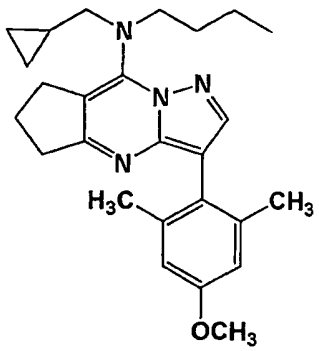


ＴＬＣ：Ｒｆ0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.81 (s, 1H), 6.68 (s, 2H), 6.40 (d, J = 9.9Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.46 (m, 1H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.22-2.02 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.20-1.06 (m, 2H), 0.68-0.36 (m, 8H)。

実施例２（３７３）

８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



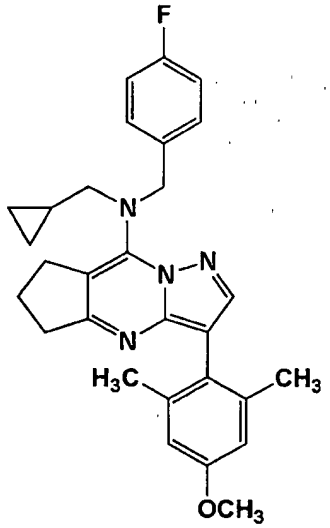
ＴＬＣ：Ｒｆ0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.87 (s, 1H), 6.69 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.76-3.60 (m, 2H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.03 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.22-

2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 6H), 1.64-1.46 (m, 2H), 1.42-1.22 (m, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.56-0.38 (m, 2H), 0.18-0.02 (m, 2H)。

実施例２（３７４）

８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－３－（２，６－ジメチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

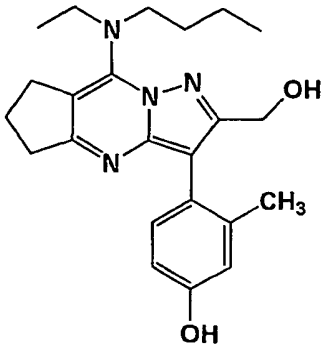


ＴＬＣ：Ｒｆ　0.51（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.92 (s, 1H), 7.38-7.26 (m, 2H), 7.06-6.94 (m, 2H), 6.71 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.39 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.22-2.00 (m, 2H), 2.13 (s, 6H), 1.01 (m, 1H), 0.54-0.40 (m, 2H), 0.10-0.01 (m, 2H)。

実施例３

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－ヒドロキシメチル－３－（２－メチル－４－ヒドロキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



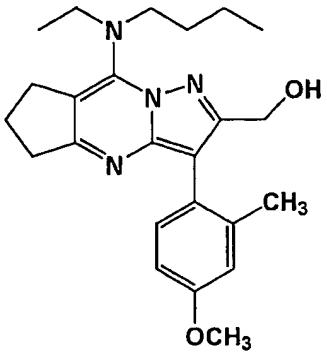
実施例２（１）で製造した化合物（５０６ｍｇ）の塩化メチレン（１４ｍｌ）溶液を－７８℃に冷却し、１Ｍ三臭化ホウ素の塩化メチレン（１２ｍｌ）溶液を加え、－７８℃で３０分間、および－３０℃で５時間撹拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１→２：３）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（３０３ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.14（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ (300MHz, $CDCl_3$)：δ 9.41 (brs, 1 H), 6.90 (d, J = 9.0Hz, 1 H), 6.42 (m, 2 H), 4.71 (brs, 2 H), 3.70 (q, J = 7.5Hz, 2 H), 3.64 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 3.01 (t, J = 7.8Hz, 4 H), 2.39 (brs, 1 H), 2.18 (m, 2 H), 2.01 (s, 3 H), 1.58 (m, 2 H), 1.35 (m, 2 H), 1.21 (t, J = 7.5Hz, 3 H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3 H)。

実施例４

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－ヒドロキシメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



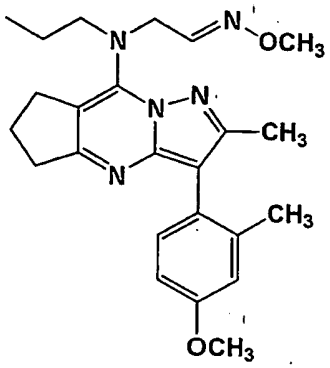
実施例３で製造した化合物（９８５ｍｇ）の塩化メチレン（１０ｍｌ）溶液を、０℃に冷却し、水素化ナトリウム（９５ｍｇ；63.1%油分散物）を加え、３０分間撹拌した。反応混合物にヨウ化メチル（0.18ｍｌ）を加え、０℃で２時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を１M水酸化ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（トルエン：酢酸エチル＝５：１→４：１→７：２）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（９４７ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.35（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR (300MHz, $CDCl_3$) : δ 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 4.73 (d, J = 5.7Hz, 2 H), 3.82 (s, 3 H), 3.65 (q, J = 7.2Hz, 2 H), 3.59 (t, J = 7.2Hz, 2 H), 2.98 (t, J = 6.9Hz, 2 H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.35 (m, 1 H), 2.19 (s, 3 H), 2.15 (m, 2 H), 1.55 (m, 2 H), 1.35 (m, 2 H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 3 H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

実施例５

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－メトキシイミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例２（２）で製造した化合物（１８６ｍｇ）のジメチルスルホキシド（５ｍｌ）溶液に、トリエチルアミン（0.39ｍｌ）および三酸化硫黄ピリジン錯体（２２５m.g）を加え、室温で２時間撹拌した。反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣のピリジン（５ｍｌ）溶液に、ｏ－メチルヒドロキシルアミン塩酸塩（２８ｍｇ）を加え、室温で１５時間撹拌した。反応混合物を濃縮し、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝４：１→３：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（１６ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.78（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：

major isomer

δ 7.57 (t, J = 5.7Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.35 (d, J = 6.0Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.49 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

minor isomer

δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.95 (t, J = 3.9Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79

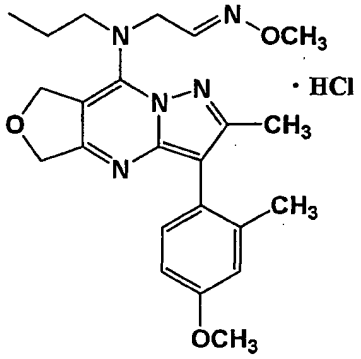
(dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.47 (d, J = 4.2Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.54 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例５（１）～５（２）

実施例２（２６）で製造した化合物、または実施例４で製造した化合物およびｏ－メチルヒドロキシルアミン塩酸塩の代わりにヒドロキシルアミン塩酸塩を用いて実施例５と同様の操作を行なって、以下の化合物を得た。

実施例５（１）

８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－メトキシイミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



ＴＬＣ：Ｒｆ 0.22（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, pyridine-d_5 0.5ml + $CDCl_3$ 0.1ml)：

major isomer

δ 7.87 (t, J = 5.4Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 4.97 (s, 2H), 4.59 (d, J = 5.4Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.38 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.65-1.50 (m, 2H),

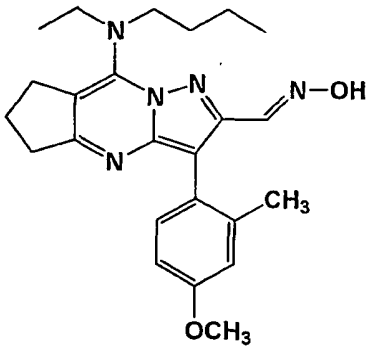
0.81 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

minor isomer

δ 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.31 (t, J = 4.2Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.71 (d, J = 4.2Hz, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.43 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.65-1.50 (m, 2H), 0.84 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例５（２）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－ヒドロキシイミノメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

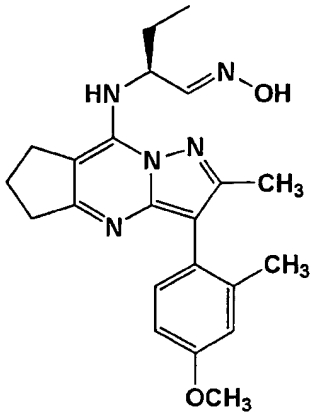


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.19（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.15 (s, 1H), 7.96 (brs, 1H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.61 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.16 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例６

８－［（２Ｓ）－１－ヒドロキシイミノブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例２（１５）で製造した化合物（２９０ｍｇ）の酢酸（４ｍｌ）溶液に、１Ｍ塩酸（1.4ｍｌ）を加え、８０℃で１時間撹拌した。反応混合物を、氷冷した飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（１００ｍｌ）に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣のピリジン（３ｍｌ）溶液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩（５２ｍｇ）を加え、室温で１５時間撹拌した。反応混合物を濃縮した後、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（１４３ｍｇ）を異性体混合物として得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ0.32（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：

major isomer

δ 7.80 (brs, 1 H), 7.47 (d, J = 6.0Hz, 1 H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.84 (d, J =

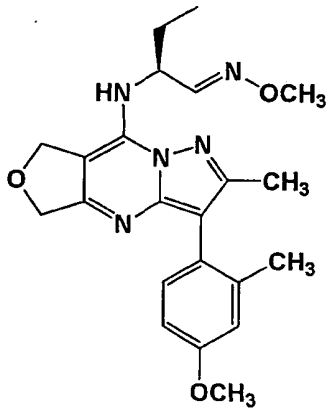
2.7Hz, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 6.53 (d, J = 9.6Hz, 1 H), 4.60 (m, 1 H), 3.82 (s, 3 H), 3.25-3.00 (m, 2 H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.10 (m, 2 H), 1.90 (m, 2 H), 1.11 (t, J = 7.2Hz, 3 H)、

minor isomer

δ 8.52 (brs, 1 H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1 H), 6.84 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.80 (m, 1 H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1 H), 6.44 (d, J = 9.6Hz, 1 H), 5.23 (m, 1 H), 3.82 (s, 3 H), 3.25-3.00 (m, 2 H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.17 (s, 3 H), 2.10 (m, 2 H), 1.90 (m, 2 H), 1.11 (t, J = 7.2Hz, 3 H)。

実施例６（１）

８－［（２Ｓ）－１－メトキシイミノブタン－２－イル］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例２（１４）で製造した化合物（３６５ｍｇ）、およびヒドロキシルアミン塩酸塩の代わりにｏ－メチルヒドロキシルアミン塩酸塩を用いて、実施例５と同様にそうさを行なって、以下の物性値を有する標題化合物（１２８ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：

major isomer

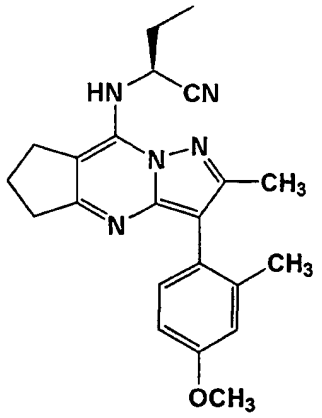
δ 7.36 (d, J = 6.0Hz, 1H), 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.60 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.47 (d, J = 10.5Hz, 1H), 5.31 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 4.07 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 2H), 1.10 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

minor isomer

δ 7.14 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.76 (m, 1H), 6.53 (d, J = 9.9Hz, 1H), 5.30 (m, 2H), 4.89 (s, 2H), 4.72 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 2H), 1.10 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例７

８－［（１Ｓ）－１－シアノプロピルアミノ］－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例６で製造した化合物（１３７ｍｇ）の塩化メチレン（１ｍｌ）溶液を－７８℃に冷却し、トリエチルアミン（0.32ｍｌ）およびトリフルオロメタ

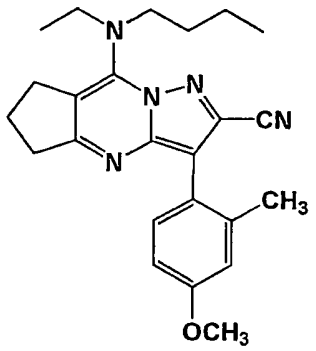
ンスルホン酸無水物（0.13ｍｌ）を加え、室温で２時間撹拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１→２：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（１００ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.27（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.50 (d, J = 9.6Hz, 1H), 4.78 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.33 (ddd, J = 14.4, 7.5, 6.3Hz, 1H), 3.11 (ddd, J = 14.4, 8.1, 6.3Hz, 1H), 2.93 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.25-2.10 (m, 7H), 1.29 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例７（１）

８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－シアノ－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例５（２）で製造した化合物（２１１ｍｇ）を用いて、実施例７と同様の操作を行なって以下の物性値を有する標題化合物（１９５ｍｇ）を得た。

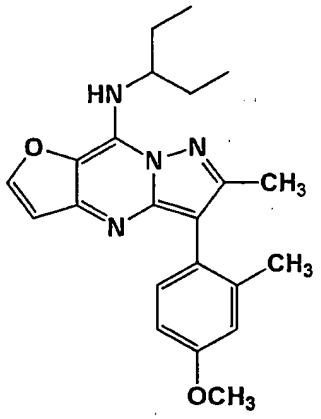
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.65 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.58 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.00 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.18 (m, 2H), 1.57 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 1.20 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例８

９－（３－ペンチルアミノ）－６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－フロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



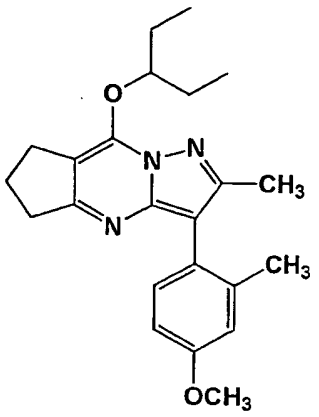
実施例２（６）で製造した化合物（２１５ｍｇ）のジフェニルエーテル（３ｍｌ）溶液に、１０％パラジウム炭素（１５０ｍｇ）を加え、２５０℃で４時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却し、メタノール（１０ｍｌ）で希釈し、セライトろ過した。ろ液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：アセトン＝９：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（１５０ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.42（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.76 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.78 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.28 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 4.30 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.92-1.65 (m, 4H), 1.05 (m, 6H)。

実施例９

８－（３－ペンチルオキシ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



水素化ナトリウム（92.0ｍｇ；６０％ in oil）のトルエン溶液に、３－ペンタノール（２０２ｍｇ）を滴下し、８０℃で２分間撹拌した。この混合物に、参考例７で製造した化合物（２５０ｍｇ）を加え、５時間撹拌した。反応溶液に水および酢酸エチルを加え、撹拌後、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝５：１）で精製し、以下の物性値を有する標題化合物（１２８ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（トルエン：アセトン＝５：１）；

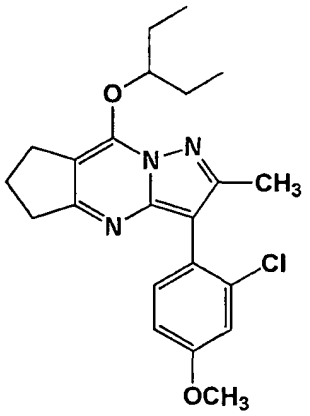
NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.05 (quint, J = 6.0Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2. 2 2 - 2.10 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 1.92 - 1.78 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例９（１）～９（５）

相当する化合物を用いて、実施例９と同様の操作を行なうことによって以下の化合物を得た。

実施例９（１）

８－（３－ペンチルオキシ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



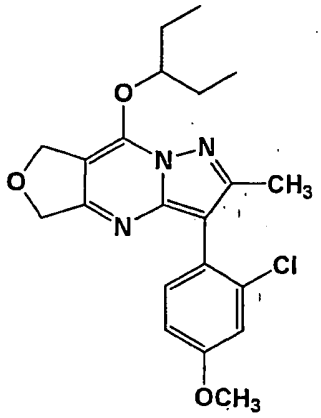
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.06 (quint, J = 6.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.1 6 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.94 - 1.74 (m, 4H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例９（２）

８－（３－ペンチルオキシ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－

a］ピリミジン

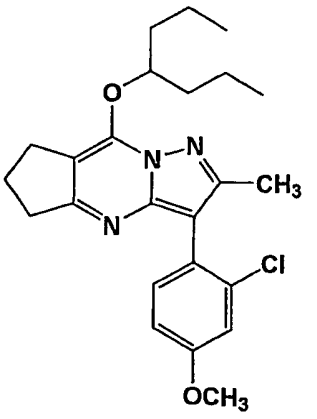


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.25（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.56 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.99 - 1.80 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例９（３）

８－（４－ヘプチルオキシ）－２－メチル－３－（２－クロロ－５－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

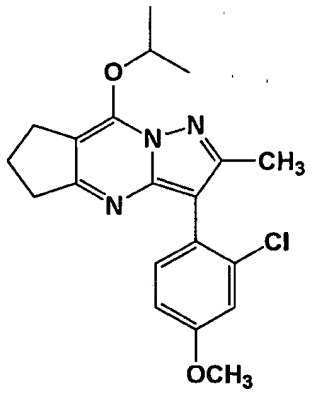


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.85（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.22 (quint, J = 6.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2. 16 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.90 - 1.66 (m, 4H), 1.58 - 1.42 (m, 4H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例９（４）

８－イソプロピルオキシ－２－メチル－３－（２－クロロ－５－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

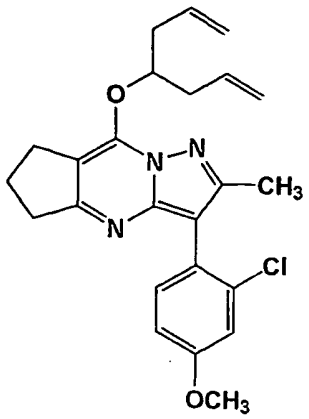


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.43 (sept, J = 6.3Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.06 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.16 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.51 (d, J = 6.3Hz, 6H)。

実施例９（５）

８－（１，６－ヘプタジエン－４－イル）オキシ－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

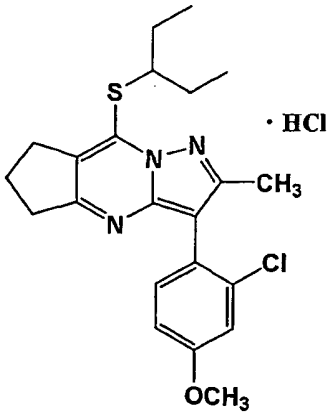


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.58（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29(d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J =2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.90 (ddt, J = 17.1, 10.2, 6.9Hz, 2H), 5.34 (quint, J = 6.3Hz, 1H), 5.17 (m, 2H), 5.11 (dd, m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.70 - 2.50 (m, 4H), 2.38 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.5Hz, 2H)。

実施例１０

８－（３－ペンチルチオ）－２－メチル－３－（２－クロロ－５－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



水素化ナトリウム（68.9ｍｇ；６０％ in oil）のエタノール（１７ｍｌ）溶

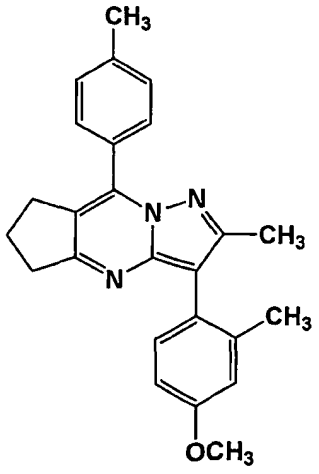
液に、０℃で、３－アセチルチオペンタン（２５２ｍｇ）および参考例７で製造した化合物（３００ｍｇ）を加え、１時間撹拌した。反応溶液を濃縮し、水および酢酸エチルを加え、撹拌し有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝５：１）で精製した。精製物に０℃で４Ｎ塩酸－酢酸エチル（0.2ｍｌ）を加え、１０分間撹拌し、その後濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（271.1ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.27 (quint, J = 6.3Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.05 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.00 (t, J = 7..5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2 .17 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.72 - 1.64 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例１１

８－（４－メチルフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



参考例７で製造した化合物（３００ｍｇ）のジメトキシエタン（３ｍｌ）溶液に、４－メチルフェニルボロン酸（１３１ｍｇ）、酢酸パラジウム（１１ｍｇ）、トリフェニルホスフィン（４８ｍｇ）および飽和炭酸ナトリウム水溶液（２ｍｌ）を加え、５時間加熱還流した。反応溶液を冷却し、酢酸エチルで希釈した。希釈液を飽和食塩水および水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝５：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（２２２ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

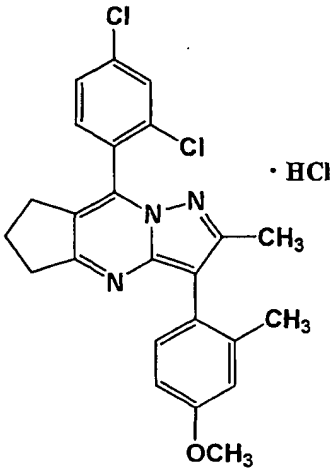
NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.72 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.01 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2. 45 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.14 (m, 2H)。

実施例１１（１）～１１（５）

相当する化合物を用いて、実施例１１と同様の操作を行なうことによって以下の化合物を得た。

実施例１１（１）

８－（２，４－ジクロロフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩

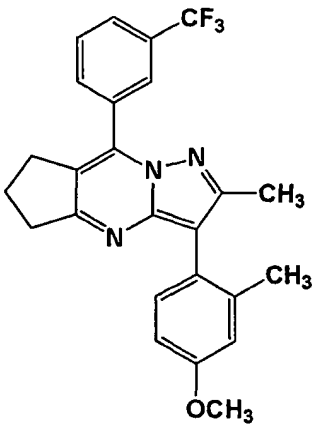


ＴＬＣ：Ｒｆ　ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 7.91 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.70 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 1.8, 8.4Hz, 1H), 7.11 (br d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J =2.7, 8.4Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.94 (m, 2H), 2.68 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 2.09 (s, 3H)。

実施例１１（２）

８－（３－トリフルオロメチルフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

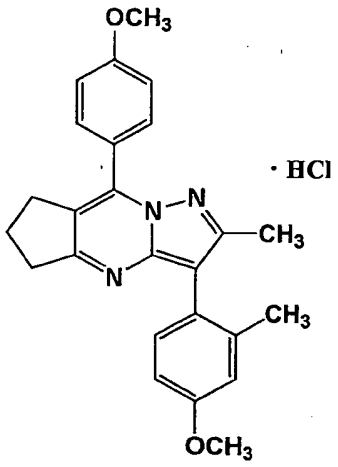


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.27（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.08 (brs, 1 H), 8.06 (brd, J = 8.1Hz, 1 H), 7.79 (brd, J = 7.8Hz, 1 H), 7.70 (brdd, J = 8.1, 7.8Hz, 1 H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1 H), 3.84 (s, 3 H), 3.04 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.94 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.31 (s, 3 H), 2.20 (s, 3 H), 2.18 (m, 2 H)。

実施例１１（３）

８－（４－メトキシフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン・塩酸塩



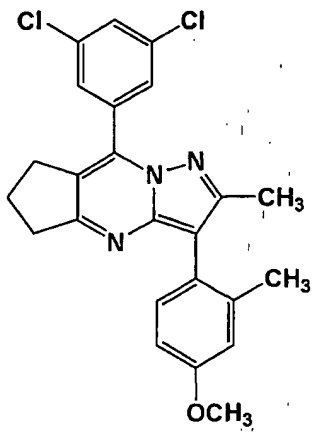
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.23（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.92 (d, J = 9.0Hz, 2 H), 7.16 (d, J = 9.0Hz, 2 H), 7.16 (d, J = 9.0Hz, 1 H), 6.92 (d, J = 2.7Hz, 1 H), 6.86 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1 H), 3.95 (s, 3 H), 3.85 (s, 3 H), 3.61 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2 H), 2.38 (s, 3 H), 2.30 (m, 2 H), 2.20 (s, 3 H)。

実施例１１（４）

８－（３，５－ジクロロフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－

メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

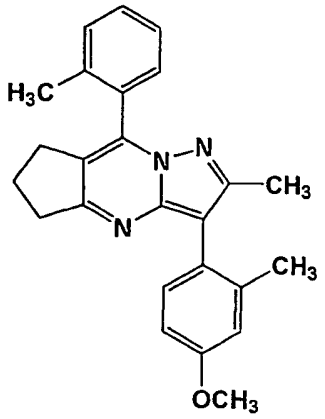


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.69 (d, J = 1.8Hz, 2H), 7.52 (t, J = 1.8Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2. 32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.17 (m, 2H)。

実施例１１（５）

８－（２－メチルフェニル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

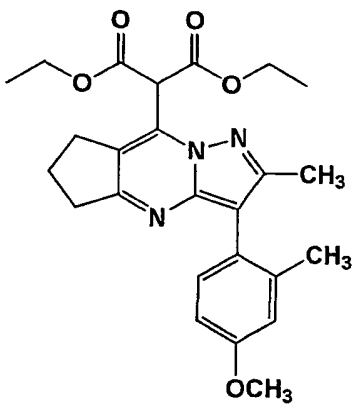


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.38（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 - 7.48 (m, 4H), 7.20 (m, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.04 (m, 2H), 2.81 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.20 (m, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.15 (m, 2H)。

実施例１２

８－ビス（エトキシカルボニル）メチル－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



水素化ナトリウム（２１０ｍｇ；63.1%in oil）のテトラヒドロフラン（１０ｍｌ）懸濁液に、マロン酸ジエチル（８８０ｍｇ）を加え、室温で３０分

間撹拌した。反応溶液に、参考例７で製造した化合物（８２０ｍｇ）を加え、４時間加熱還流した。反応溶液に飽和塩化アンモニウム水溶液（１０ｍｌ）を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝８：１→７：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（1.10ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.48（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）；

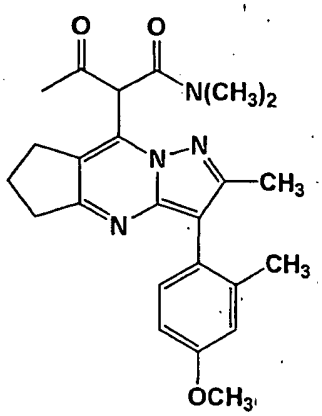
NMR(300MHz, $CDCl_3$): δ 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1 H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1 H), 6.80 (dd, J = 8.1, 3.0Hz, 1 H), 6.02 (s, 1 H), 4.32 (m, 4 H), 3.82 (s, 3 H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2 H), 2.32 (s, 3 H), 2.21 - 2.09 (m, 2 H), 2.17 (s, 3 H), 1.32 (t, J = 7.2Hz, 6 H)。

実施例１２（１）～１２（４）

相当する化合物を用いて、実施例１２と同様の操作を行なうことによって以下の化合物を得た。

実施例１２（１）

８－（１－ジメチルアミノ－１，３－ジオキソ－２－ブチル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

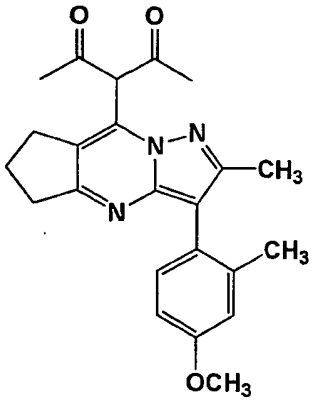


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（酢酸エチル）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.83 - 6.74 (m, 1H), 6.29 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 3.05 - 2.60 (m, 6H), 2.41 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.16 (brs, 6H)。

実施例１２（２）

８－（２，４－ジオキソ－３－ペンチル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



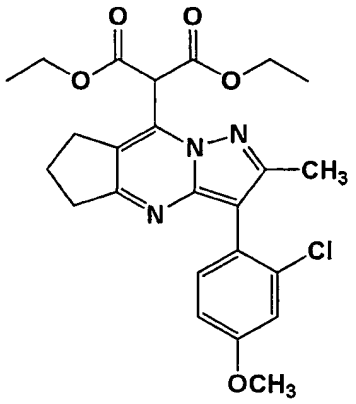
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 16.93 (s, 1H), 7.19 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.04 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.81

(t, J = 7.2Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (quint, J = 7 .2Hz, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.95 (s, 6H)。

実施例１２（３）

８－ビス（エトキシカルボニル）メチル－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

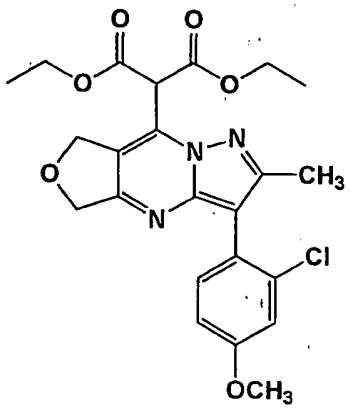


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.18（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.02 (s, 1H), 4.40 - 4.20 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.17 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例１２（４）

８－ビス（エトキシカルボニル）メチル－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン

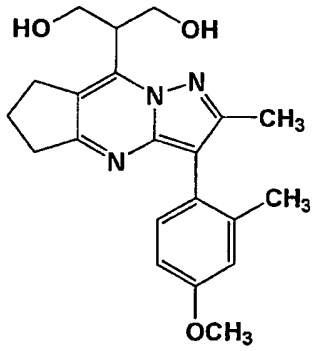


ＴＬＣ：Ｒｆ 0.28（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.41 - 4.20 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.33 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例１３

８－（１，３－ヒドロキシ－２－プロピル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



アルゴン雰囲気下、実施例１２で製造した化合物（３５５ｍｇ）の脱水ジエチルエーテル（７ｍｌ）溶液に、－７８℃で１Ｍジイソプロピルアルミニウムヒドリド（3.94ｍｌ；ヘキサン溶液）を滴下した。混合溶液を０℃に昇温

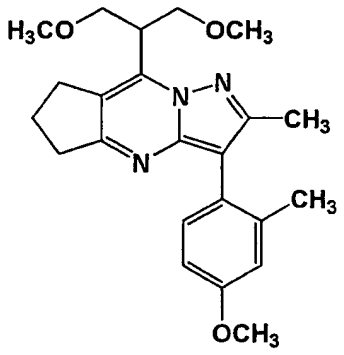
し、4.5時間撹拌した。反応溶液にメタノール（３ｍｌ）を滴下し、室温に昇温した。反応溶液に１Ｎ塩酸水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）で精製し、以下の物性値を有する標題化合物（２６０ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.50（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.13 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.80 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 4.97 (m, 1H), 4.90 (m, 1H), 4.24 (m, 2H), 4.13 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.59 (m, 1H), 2.98 (brt, J = 7.2Hz, 4H), 2.31 (s, 3H), 2.28-2.00 (m, 5H)。

実施例１４

８－（１，３－ジメトキシ－２－プロピル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



水素化ナトリウム（26.0ｍｇ；６０%in oil）のＤＭＦ溶液に、０℃で実施例１３で製造した化合物（１２０ｍｇ）のＤＭＦ（２ｍｌ）溶液を滴下した。この混合物にヨウ化メチル（81.0μｌ）を滴下し、１時間撹拌した。反応溶液に水および酢酸エチルを加え、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム

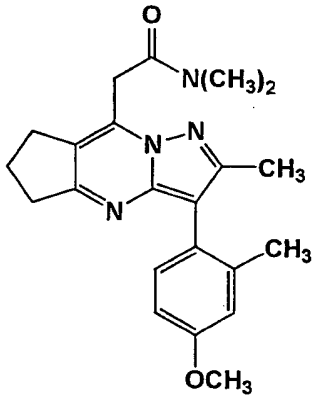
で乾燥後、ベンゼン（５ｍｌ）を加えてから濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（58.7ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.80（酢酸エチル）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.28 - 4.16 (m, 1H), 4.14 - 4.06 (m, 2H), 3.96 - 3.86 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.35 (s, 6H), 3.06 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2 .94 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H)。

実施例１５

８－（Ｎ，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチル）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン



実施例１２で製造した化合物（４１０ｍｇ）のメタノール（１ｍｌ）溶液に、２４℃でジメチルアミノ（４９１ｍｇ）の５０％水溶液を加え、９０℃で２０時間撹拌した。反応溶液を室温まで冷却し、水および酢酸エチルを加え、撹拌後、有機層を分離した。さらに、水層を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝

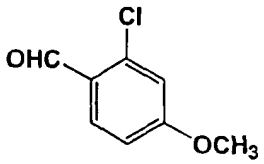
５：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（102.7ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.55（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.27 (d, J = 1.2Hz, 1H), 3.04 - 2.94 (m, 5H), 2.72 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.24 - 2.10 (m, 8H)。

参考例８

２－クロロ－４－メトキシベンズアルデヒド



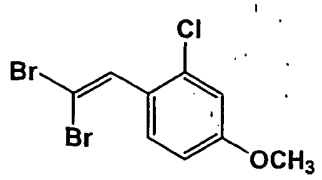
水素化ナトリウム（2.6ｇ；62.6% in oil）のジメチルホルムアミド（８０ｍｌ）懸濁液に、０℃で２－クロロ－４－ヒドロキシベンズアルデヒド（10.0ｇ）のジメチルホルムアミド（５０ｍｌ）溶液を１５分かけて滴下し、３０分間撹拌した。反応溶液に、０℃でヨウ化メチル（4.2ｍｌ）を１０分かけて滴下し、１時間撹拌した。反応溶液を水に注ぎ、ヘキサン／酢酸エチル（１：１）で抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（10.7ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.61（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 10.33 (d, J = 0.6Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (ddd, J = 9.0, 2.4, 0.6Hz, 1H), 3.89 (s, 3H)。

参考例９

１－（２，２－ジブロモエテニル）－２－クロロ－４－メトキシベンゼン



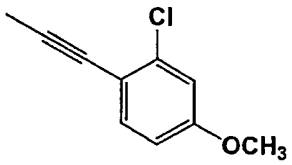
参考例８で製造した化合物（5.0ｇ）の塩化メチレン（１４０ｍｌ）溶液に、四臭化炭素（10.7ｇ）を加え、氷浴下、トリフェニルホスフィン（16.9ｇ）を内温５℃以下を保ちながら少しずつ加えた。混合物を０℃で３０分間撹拌した。反応混合物のヘキサン（５００ｍｌ）懸濁液を、シリカゲル（３０ｇ）に注ぎ、ろ過した。シリカゲルをヘキサン／酢酸エチル（１０：１）で洗浄した。ろ液および洗浄液を合わせ、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（6.6ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.82（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.62 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 6.94 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 9.0, 2.1Hz, 1H), 3.81 (s, 3H)。

参考例１０

１－（１－プロピニル）－２－クロロ－５－メトキシベンゼン



参考例９で製造した化合物（1.98ｇ）のテトラヒドロフラン（２０ｍｌ）溶液に、－７８℃で1.57Mのｎ－ブチルリチウムヘキサン溶液（8.2ｍｌ）を加え、３０分間撹拌し、０℃で１時間撹拌した。反応溶液を再び－７８℃に冷却し、ヨウ化メチル（0.46ｍｌ）を加え、０℃で１時間撹拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸

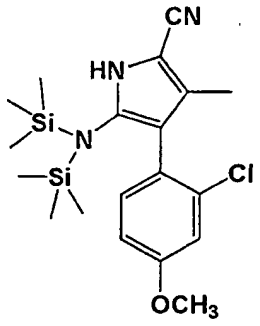
マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）で精製して、以下の物性を有する標題化合物（0.89ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.69（ヘキサン：酢酸エチル＝５：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.91 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.73 (d, J = 8.7Hz, 2.7Hz, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

参考例１１

５－ビス（トリメチルシリル）アミノ－２－シアノ－３－メチル－４－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）ピロール



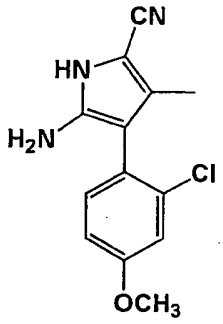
３０分間加熱乾燥した塩化ニッケル（８３２ｇ）に、アルゴン置換下、ジイソブチルアルミニウムヒドリド（13.8ｍｌ）を室温でゆっくり加え、１５分間撹拌した。反応溶液が黒変した後、参考例１０で製造した化合物（11.6ｇ）のトリメチルシリルシアニド（４６ｍｌ）溶液を２５分かけて加えた。混合溶液を加熱し、ヘキサンを留去した後、１３０℃で２時間半撹拌した。反応溶液を室温まで冷却し、塩化メチレンで希釈した。希釈液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（9.5ｇ）、および副生成物として２－ビス（トリメチルシリル）アミノ－５－シアノ－３－メチル－４－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）ピロール（５．２ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.34（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.76 (brs, 1H), 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 0.14 (s, 9H), -0.14 (s, 9H)。

参考例１２

５－アミノ－２－シアノ－３－メチル－４－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）ピロール



参考例１１で製造した化合物（6.27ｇ）のメタノール（５０ｍｌ）溶液に、１Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（15.4ｍｌ）を室温で加え、１時間半加熱還流した。反応溶液を室温まで冷却後、炭酸ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物（4.78ｇ）を得た。

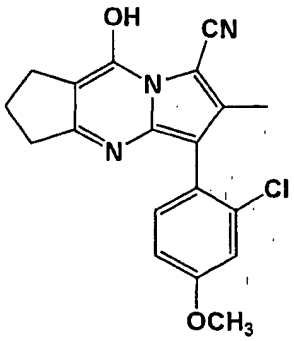
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.20（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 8.61 (brs, 1H), 7.14 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.71 (brs, 2H), 2.04 (s, 3H)。

実施例１６

１－シアノ－２－メチル－８－ヒドロキシ－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピロロ［１，

２－ａ］ピリミジン



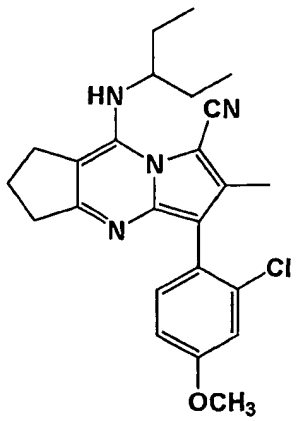
参考例１２で製造した化合物（4.15ｇ）を用いて、実施例１と同様の操作を行なうことによって、以下の物性値を有する標題化合物（1.35ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.15（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, DMSO-d_6)：δ 12.25 (brs, 1H), 7.31 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.20 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 7.8, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.83 (m, 2H), 2.66 (m, 2H), 2.06 (s, 3H), 2.03 (m, 2H)。

実施例１７

１－シアノ－２－メチル－８－（３－ペンチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン



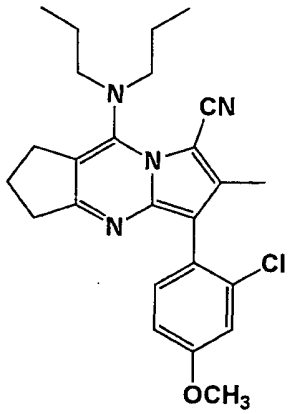
実施例１６で製造した化合物を用いて、参考例７と同様の操作を行なうことによって製造した１－シアノ－２－メチル－８－クロロ－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン（１８０ｍｇ）を用いて、実施例２と同様の操作を行なうことによって、以下の物性値を有する標題化合物（１１２ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.36（トルエン：酢酸エチル＝９：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.25 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.94 (d, J = 9.0Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.82 (m, 1H), 3.04 (m, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.82-1.60 (m, 4H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例１７（１）

１－シアノ－２－メチル－８－ジプロピルアミノ－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン



相当する化合物を用いて参考例８→参考例９→参考例１０→参考例１１→

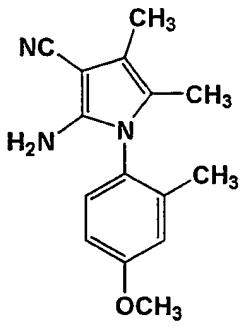
参考例１２→実施例１６→実施例１７と同様の操作を行うことによって以下の物性値を有する標題化合物を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.39（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.26 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.35-3.13 (m, 4H), 3.00-2.80 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.14 (m, 2H), 1.81-1.38 (m, 4H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

参考例１３

５－アミノ－４－シアノ－２，３－ジメチル－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）ピロール



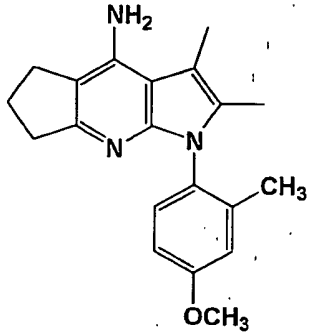
２－メチル－４－メトキシアニリン（１０ｇ）のトルエン（１２０ｍｌ）溶液に、アセトイン（6.43ｇ）およびｐ－トルエンスルホン酸・水和物（４４ｍｇ）を加え、混合物を２時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却後、マロノニトリル（4.6ｍｌ）を加え、１２時間加熱還流した。冷却した反応溶液を濃縮し、残渣をエーテルで希釈した後、析出物をろ取して、以下の物性値を有する標題化合物（5.73ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.65（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.07 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.71 (brs, 2H), 2.06 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.73 (s, 3H)。

実施例１８

２，３－ジメチル－４－アミノ－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



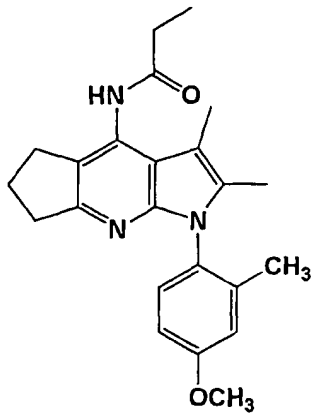
参考例１３で製造した化合物（4.0ｇ）のベンゼン（４０ｍｌ）溶液に、シクロペンタノン（1.46ｍｌ）およびｐ－トルエンスルホン酸・水和物（４０ｍｇ）を加え、脱水しながら１２時間加熱還流した。不溶物をセライトろ過し、ろ液を濃縮した。アルゴン雰囲気下、残渣の無水テトラヒドロフラン（ＴＨＦ）（８０ｍｌ）溶液に、０℃で２Ｍリチウムジイソプロピルアミド（15.7ｍｌ；ＴＨＦ溶液）を加え、室温まで昇温し、５日間撹拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）で精製して、以下の物性値値を有する標題化合物（2.85ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.51（クロロホルム：メタノール＝１０：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.80(dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.90 (m, 2H), 2.74 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.10 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.90 (s, 3H)。

実施例１９

２，３－ジメチル－４－エチルカルボニルアミノ－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



実施例１８で製造した化合物（６００ｍｇ）のＴＨＦ（６０ｍｌ）溶液に、０℃でトリエチルアミン（５２０μｌ）およびプロピオン酸クロリド（１８０μｌ）を加え、２時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、希釈液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をヘキサンで洗浄して、以下の物性値を有する標題化合物（４５１ｍｇ）を得た。

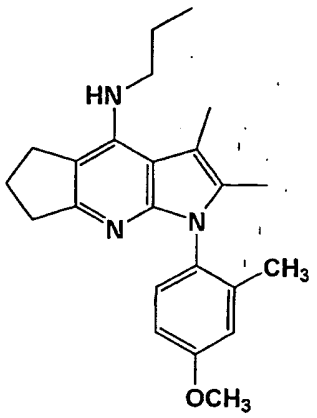
ＴＬＣ：Ｒｆ 0.60（クロロホルム：メタノール＝１０：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.30 (m, 1H), 7.08 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.51 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.09 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.33 (m, 3H)。

実施例２０

２，３－ジメチル－４－プロピルアミノ－１－（２－メチル－４－メトキシ

フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



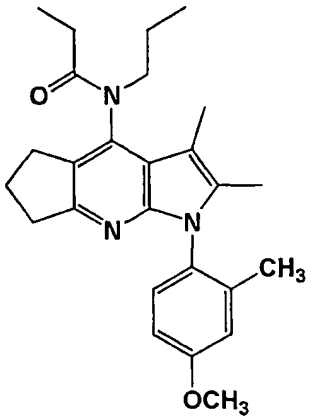
実施例１９で製造した化合物（４５１ｍｇ）のＴＨＦ（5.0ｍｌ）溶液に、２Ｍボランジメチルスルフィド錯体（4.8ｍｌ：ＴＨＦ溶液）を加え、５時間加熱還流した。反応混合物にメタノールを加え、さらに２時間加熱還流した。反応溶液を冷却後、酢酸エチルで希釈した。希釈液を水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（２６８ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.47（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.09 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.43 (m, 2H), 3.05 (m, 2H), 2.84 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.04 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例２１

２，３－ジメチル－４－（Ｎ－エチルカルボニル－Ｎ－プロピルアミノ）－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



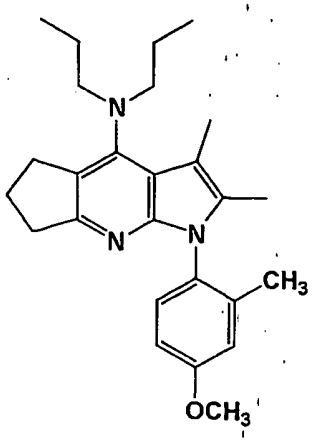
実施例２０で製造した化合物（２３４ｍｇ）の塩化メチレン（3.0ｍｌ）溶液に、アルゴン雰囲気下、０℃でトリエチルアミン（３６０μｌ）およびプロピオン酸クロリド（１３４μｌ）を加え、１時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）で精製して、以下の物性値を有する標題化合物（２４２ｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.57（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.11 (m, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.42 (m, 1H), 3.01 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.87 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.94-2.20 (m, 4H), 2.05 (s, 3H), 1.92 and 1.90 (s, total 3H), 1.63 (m, 2H), 0.99-1.10 (m, 3H), 0.85-0.94 (m, 3H)。

実施例２２

２，３－ジメチル－４－ジプロピルアミノ－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



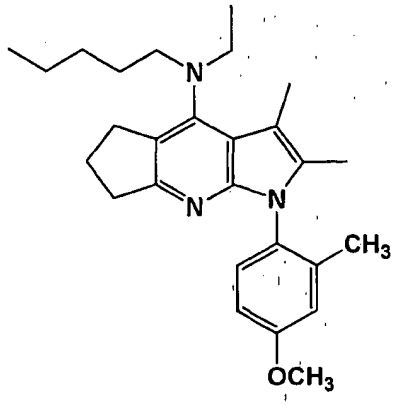
実施例２１で製造した化合物（２４２ｍｇ）を用いて、実施例２０と同様の操作を行うことによって、以下の物性値を有する標題化合物（１８２ｍｇ）を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.45（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

NMR(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.17 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.92 (s, 3H), 1.52 (m, 4H), 0.85 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例２２（１）

２，３－ジメチル－４－（Ｎ－エチル－Ｎ－ペンチルアミノ）－１－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｅ］ピロロ［２，３－ｂ］ピリジン



実施例１８で製造した化合物および相当する化合物を用いて、実施例１９→実施例２０→実施例２１→実施例２２と同様の操作を行うことによって、以下の物性値を有する標題化合物を得た。

ＴＬＣ：Ｒｆ 0.41（ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）；

ＮＭＲ(300MHz, $CDCl_3$)：δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.27 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.18 (m, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.91 (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.38-1.20 (m, 4H), 1.05 (t, J = 6.9Hz, 3H), 0.86 (t, J = 6.9Hz, 3H)。

［製剤例］

製剤例１

以下の各成分を常法により混合した後打錠して、一錠中に５０ｍｇの活性成分を含有する錠剤１００錠を得た。

・８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン …… 5.0ｇ

・カルボキシメチルセルロースカルシウム（崩壊剤） …… 0.2ｇ

・ステアリン酸マグネシウム（潤滑剤） …… 0.1ｇ

・微結晶セルロース …… 4.7ｇ

製剤例２

以下の各成分を常法により混合した後、溶液を常法により滅菌し、５ｍｌずつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、１アンプル中２０ｍｇの活性成分を含有するアンプル１００本を得た。

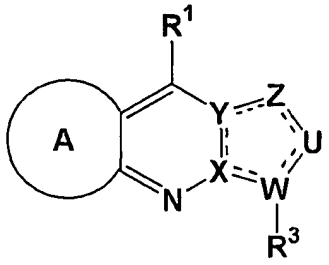
・８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン …… 2.0ｇ

・マンニトール …… 20ｇ

・蒸留水 …… 500ｍｌ

請 求 の 範 囲

1. 一般式（I）



(I)

(式中、

XおよびYはそれぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表わし（ただし、二つは同時に窒素原子を表わさない。）、

Wは炭素原子または窒素原子を表わし、

UおよびZはそれぞれ独立して、CR^2、NR^{13}、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、C＝OまたはC＝Sを表わし、

R^2は

(i)水素原子、

(ii)C１～８アルキル、

(iii)C２～８アルケニル、

(iv)C２～８アルキニル、

(v)ハロゲン原子、

(vi)CF_3、

(vii)シアノ、

(viii)ニトロ、

(ix)NR^9R^{10}（基中、R^9およびR^{10}はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

(ii)C１～４アルキル、

(iii) Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(iv) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(v) Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、もしくは１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(x) OR^{11}（基中、R^{11}は

(i) 水素原子、

(ii) Ｃ１～４アルキル、

(iii) Ｃ５～６の炭素環、

(iv) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(v) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xi) ＳＨ、

(xii) $S(O)_nR^{12}$（基中、ｎは０、１または２を表わし、R^{12}は

(i) Ｃ１～４アルキル、

(ii) Ｃ５～６の炭素環、

(iii) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(iv) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii) COR^{11}、

(xiv) $COOR^{11}$、

(xv) $CONR^{9}R^{10}$、

(xvi) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(xvii) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(xviii) ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、$NR^{9}R^{10}$、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^{9}R^{10}$、C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているC１～４アルキルを表わし、

R^{13}は

(i) 水素原子、

(ii) C１～４アルキル、

(iii) C２～４アルケニル、

(iv) C２～４アルキニル、

(v) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、または１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されているC１～４アルキルを表わし、

---- は単結合または二重結合を表わし、



はC１～４アルキル、C１～４アルコキシ、ハロゲン原子およびCF_3から選

ばれる基１～３個で置換されているか、もしくは無置換のＣ４～６炭素環、または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環を表わし、

R^1は

(i) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～８アルキル、

(ii) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルケニル、

(iii) １～５個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルキニル、

(iv) NR^4R^5（基中、R^4およびR^5はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

(ii) １～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、

(iii) １～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、

(iv) １～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、

(v) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わす。）、

(v) OR^6（基中、R^6は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～１０アルキル、

(iii)Ｃ２～１０アルケニル、

(iv) C２～１０アルキニル、

(v) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC３～１５の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているC１～４アルキルを表わす。）、

(vi) SH、

(vii) $S(O)_nR^7$（基中、nは前記と同じ意味を表わし、R^7は

(i) C１～８アルキル、

(ii) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(iii) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(iv) １～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、または１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二

環式複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(viii) COR^6、

(ix) $COOR^6$、

(x) $CONR^4R^5$、

(xi) NR^8COR^{6a}（基中、R^{6a}は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～１０アルキル、

(iii)Ｃ２～１０アルケニル、

(iv)Ｃ２～１０アルキニル、

(v)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11a}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、および$CONR^9R^{10}$から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xii) NR^8COOR^6（基中、R^6は前記と同じ意味を表わし、R^8は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～８アルキル、

(iii)Ｃ２～８アルケニル、

(iv)Ｃ２～８アルキニル、

(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の

Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のＲ[18]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii)ＮＲ[8]ＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]、

(xiv)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または

(xv)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

Ｒ[11a]は(i)水素原子、(ii)Ｃ１～４アルキル、または(iii)Ｃ５～６の炭素環または１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わし、

Ｒ[14]は(a)ハロゲン原子、(b)ＣＦ$_3$、(c)ＯＣＦ$_3$、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)ＮＲ[4]Ｒ[5]、(g)ＯＲ[6]、(h)＝Ｎ－ＯＲ[6]、(j)ＳＨ、(k)Ｓ(Ｏ)$_n$Ｒ[7]、(l)ＣＯＲ[6]、(m)ＣＯＯＲ[6]、(n)ＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]、(o)ＮＲ[8]ＣＯＲ[6]、(p)ＮＲ[8]ＣＯＯＲ[6]、(q)ＮＲ[8]ＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]、(r)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(s)１～５個のＲ[15]で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

Ｒ[15]は(a)Ｃ１～８アルキル、(b)Ｃ２～８アルケニル、(c)Ｃ２～８アルキニル、(d)Ｃ１～４アルコキシ（Ｃ１～４）アルキル、(e)ハロゲン原子、(f)ＣＦ$_3$、(g)ＯＣＦ$_3$、(h)シアノ、(j)ニトロ、(k)ＮＲ[4]Ｒ[5]、(l)ＯＲ[6]、(m)ＳＨ、(n)Ｓ(Ｏ)$_n$Ｒ[7]、(o)ＣＯＲ[6]、(p)ＣＯＯＲ[6]、(q)ＣＯＮＲ[4]Ｒ[5]、(r)

NR^8COR^6、(s)NR^8COOR^6、(t)$NR^8CONR^4R^5$、(u)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、(v)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、(w)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^4R^5、OR^6、$=N-OR^6$、SH、$S(O)_nR^7$、COR^6、$COOR^6$、$CONR^4R^5$、NR^8COR^6、NR^8COOR^6、$NR^8CONR^4R^5$、１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わし、

R^{17}は(a)ハロゲン原子、(b)CF_3、(c) OCF_3、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)NR^9R^{10}、(g)OR^{11a}、(h)$=N-OR^{11}$、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)COR^{11}、(m)$COOR^{11}$、(n)$CONR^9R^{10}$、(o)NR^8COR^{11}、(p)NR^8COOR^{11}、(q)$NR^8CONR^9R^{10}$、(r)１～５個のR^{18a}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(s)１～５個のR^{18a}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{18}は(a)Ｃ１～４アルキル、(b)Ｃ２～４アルケニル、(c)Ｃ２～４アルキニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF_3、(f)OCF_3、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)NR^9R^{10}、(m)OR^{11}、(n)COR^{11}、(o)$COOR^{11}$、(p)$CONR^9R^{10}$、(q)Ｃ５～６の炭素環、(r)１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または(s)Ｃ５～６の炭素環または１～２個の窒素原子、１個の酸素原

子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルで置換されたＣ１～４アルキル表わし、

R^{18a}は(a)Ｃ１～４アルキル、(b)Ｃ２～４アルケニル、(c)Ｃ２～４アルキニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF_3、(f)OCF_3、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)ＳＨ、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)NR^9R^{10}、(m)OR^{11a}、(n)COR^{11}、(o)$COOR^{11}$、または(p)$CONR^9R^{10}$を表わし、

R^{19}はＣ１～４アルキル、Ｃ１～４アルコキシ、ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、アミノ、ＮＨ（Ｃ１～４アルキル）、またはＮ（Ｃ１～４アルキル）$_2$を表わし、

R^3は(i)１～５個のR^{16}によって置換されているＣ５～１０の単環もしくは二環式炭素環、または

(ii)１～５個のR^{16}によって置換されている１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する５～１０員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{16}は、

(a)Ｃ１～８アルキル、

(b)Ｃ２～８アルケニル、

(c)Ｃ２～８アルキニル、

(d)ハロゲン原子、

(e)CF_3、

(f)OCF_3、

(g)シアノ、

(h)ニトロ、

(j)NR^9R^{10}、

(k)OR^{11}、

(l)ＳＨ、

(m) $S(O)_nR^{12}$（ただし、フェニルチオは除く。）、

(n) COR^{11}、

(o) $COOR^{11}$、

(p) $CONR^9R^{10}$、

(q) NR^8COR^{11}、

(r) NR^8COOR^{11}、

(s) $NR^8CONR^9R^{10}$、

(t) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(u) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(v) ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、NR^8COR^{11}、NR^8COOR^{11}、$NR^8CONR^9R^{10}$、C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているC１～４アルキルを表わす。

ただし、（１）XおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子、UがCR^4、かつR^1がOR^6を表わすとき、R^3は１個のハロゲンで置換されたフェニル、１個のトリフルオロメチルで置換されたフェニル、トリフルオロメチルおよびニトロで置換されたフェニルは表わさず、（２）X、YおよびZが炭素原子であり、UおよびWが窒素原子の時、R^3は１～５個のR^{16}によって置換されているC５～１０の単環もしくは二環式炭素環である。）

で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

２．　Xが炭素原子、Yが窒素原子であり、UおよびZが炭素原子または窒

素原子、およびWが炭素原子である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

３．　X、UおよびWが炭素原子、YおよびZが窒素原子である請求の範囲２に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

４．　X、Z、UおよびWが炭素原子、Yが窒素原子である請求の範囲２に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

５．　X、Y、ZおよびUが炭素原子、Wが窒素原子である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

６．　一般式（Ｉ）中、式



で示される環がＣ４～６炭素環である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

７．　一般式（Ｉ）中、式



で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

８．　R^1が

(i) １～５個のＲ^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～８アルキル、

(ii) １～５個のＲ^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルケニル、

(iii) １～５個のＲ^{14}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～８アルキニル、

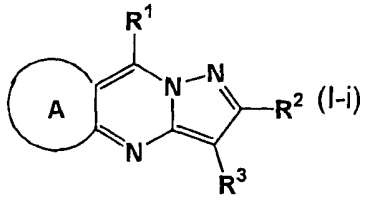
(iv) ＮＲ^{4}Ｒ^{5}、

(v) ＯＲ^{6}、

(vi) １～５個のＲ^{15}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または

(vii) １～５個のＲ^{15}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環（基中、Ｒ^{14}およびＲ^{15}は請求の範囲１と同じ意味を表わす。）である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

９．　一般式（Ｉ）で示される化合物が式（Ｉ－ｉ）



（式中、すべての記号は請求の範囲１と同じ意味を表わす。）で示される化合物である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１０．　一般式（Ｉ－ｉ）中、式



で示される環がＣ４～６炭素環である請求の範囲９に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１１．　一般式（Ｉ－ｉ）中、式



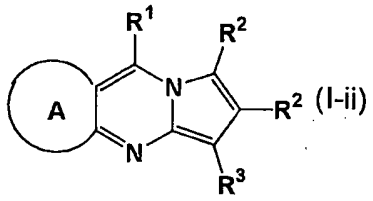
で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環である請求の範囲９に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１２．　R^1がNR^4R^5であり、かつ(a)R^4が(i)水素原子であり、R^5が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環であるか、または

(b)R^4が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、または(v-1)Ｃ３～６の単環の飽和炭素環であり、

R^5が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環（基中、R^{17}およびR^{18}は請求の範囲１と同じ意味を表わす。）である請求の範囲９に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１３．　一般式（Ｉ）で示される化合物が式（Ｉ－ii）



（式中、すべての記号は請求の範囲１と同じ意味を表わす。）で示される化合物である請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１４．　一般式（Ｉ－ii）中、式



で示される環がＣ４～６炭素環である請求の範囲１３に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１５．　一般式（Ｉ－ii）中、式



で示される環が窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６員の複素環である請求の範囲１３に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１６．　R^1がNR^4R^5であり、かつ(a)R^4が(i)水素原子であり、R^5が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環であるか、または

(b)R^4が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、または(v-1)Ｃ３～６の単環の飽和炭素環であり、R^5が(ii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ１～１５アルキル、(iii)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルケニル、(iv)１～５個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のＣ２～１５アルキニル、(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、(vi)１～５個のR^{18}で置換さ

れているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環である請求の範囲１３に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

１７．　化合物が、

(1) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(2) ８－（Ｎ－エチル－Ｎ－ｎ－ブチルアミノ）－２－メトキシメチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(3) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(4) ９－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，６，７，８－テトラヒドロピラゾロ［３，２－ｂ］キナゾリン、

(5) ８－［（２Ｓ）－１，１－ジメトキシブタン－２－イル］］アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(6) ８－（１，３－ジメトキシプロパン－２－イル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(7) ８－ビス（２－メトキシエチル）アミノ－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］

ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(8) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，4－ジクロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(9) 8－ジエチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(10) 8－（N－エチル－N－n－ブチルアミノ）－2－メチル－3－（2，4－ジクロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(11) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(12) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メトキシメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(13) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（1，3－ジオキサインダン－5－イル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(14) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（3，4－ジメトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(15) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－シクロブチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(16) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－エチル－3－（2－メチル－4－メ

トキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(17) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－イソプロピル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(18) 8－（2－エチルブチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(19) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチルチオメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(20) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，4－ジメチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(21) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジメチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(22) 8－シクロブチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(23) 8－（N－エチル－N－シクロブチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(24) 8－（プロパン－1，3－ジオール－2－イル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(25) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－（2－フリル）－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(26) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－フェニル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(27) 8－（2－ジメチルアミノエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(28) 8－（N－メチル－N－（2－ジメチルアミノエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(29) 8－（N－エチル－N－（2－ジメチルアミノエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(30) 8－（4－ヘプチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(31) 8－（2－ブチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(32) 8－（N－プロピル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(33) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］

ピリミジン、

(34) 8－［（2R）－1－メトキシブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(35) 8－［（2S）－1－メトキシブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(36) 8－シクロペンチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(37) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，4－ジフルオロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(38) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－トリフルオロメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(39) 8－（N－エチル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(40) 8－シクロヘキシルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(41) 8－（N－プロピル－N－（3－ペンチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(42) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（4－メトキシフェニ

ル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(43) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－イソプロピル－3－（4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(44) 8－t－ブチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(45) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2，4，6－トリメチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(46) 8－（1－シクロブチルエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(47) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，3－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(48) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(49) 8－（N－（2，2，2－トリフルオロエチル）－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(50) 8－（2，2，2－トリフルオロエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペン

タ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(51) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(52) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（4，6－ジメチル－2－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(53) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(54) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(55) 8－（3－メチルペンタン－3－イル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(56) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（5－クロロ－1，3－ジオキサインダン－6－イル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(57) 8－（N－エチル－N－ベンジルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(58) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－トリフルオロメトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(59) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メ

トキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(60) 8－（N－ベンジル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(61) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシ－4，5－ジメチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(62) 8－フェニルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(63) 8－（2－メチルフェニル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(64) 8－（3－メチルフェニル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(65) 8－（4－メチルフェニル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(66) 8－（N－フェニル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(67) 8－（N－ベンジル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(68) 8－（N，N－ジアリルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(69) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－ジメチルアミノフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(70) 8－（1－フェニルプロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(71) 8－（N－（2－フェニルエチル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(72) 8－（N－（3－フェニルプロピル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(73) 8－（N－（4－フェニルブチル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(74) 8－（1－フェニル－2－ブチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(75) 8－（1－フェニル－3－ペンチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(76) 8－（N－（4－メチルフェニル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H

－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(77) 8－（N－（4－メチルフェニル）メチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(78) 8－（N－（3－メチルフェニル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(79) 8－（N－（4－メトキシフェニル）メチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(80) 8－（N－（4－クロロフェニル）メチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(81) 8－（N－（2－メチルフェニル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(82) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－ジメチルアミノ－4－メチルピリジン－5－イル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(83) 8－（（2S）－1－メトキシ－3－フェニル－2－プロピル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(84) 8－（N－（4－メチルチオフェニル）メチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(85) 8－（N，N－ジブチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4

ーメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(86) ８－（Ｎ－メチル－Ｎ－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(87) ８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－ブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(88) ８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(89) ８－（Ｎ－シクロプロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(90) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(91) ８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(92) ８－（Ｎ－（４－メチルフェニル）メチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(93) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３

－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(94) ８－（５－ノニルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(95) ８－（Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(96) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(97) ８－（Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(98) ８－（Ｎ－シクロブチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(99) ８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(100) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(101) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（テトラヒドロフラン－２－イル）メチル

アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(102) ８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(103) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－シクロプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(104) ８－（Ｎ－シクロブチルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(105) ８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(106) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(107) ８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチリル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(108) ８－（２－ブチリルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(109) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，

7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(110) 8－（N－プロピル－N－（4－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(111) 8－（N－（2－ブチリル）－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(112) 8－（N－プロピル－N－（3－メチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(113) 8－（N－プロピル－N－（2－メチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(114) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－エトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(115) 8－（N－メチル－N－ヘキシルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(116) 8－（N－メチル－N－（3－ペンチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(117) 8－（N－メチル－N－（4－ヘプチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シク

ロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(118) 8－（N－シクロブチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(119) 8－（N－イソブチル－N－（2－ジメチルアミノエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、2

(120) 8－（N－プロピル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(121) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(122) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（3－クロロ－5－トリフルオロメチルピリジン－2－イル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、2

(123) 8－（N－ブチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(124) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(125) 8－（N－プロピル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(126) 8－（Nープロピルー Nー（3ーフルオロフェニル）メチルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(127) 8ージシクロプロピルメチルアミノー2ーメチルー3ー（2ークロロー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(128) 8ー（Nーブチルー Nープロピルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ークロロー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(129) 8ー（Nーシクロプロピルメチルー Nープロピルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ークロロー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(130) 8ー（Nー（2ーブチニル）ーNープロピルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ークロロー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(131) 8ー（Nーブチルー Nー（2ーメトキシエチル）アミノ）ー2ーメチルー3ー（2ークロロー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(132) 8ー（Nーシクロプロピルメチルー Nー（4ーフルオロフェニル）メチルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(133) 8ー（3ーペンチルアミノ）ー2ーメチルー3ー（3，5ージクロロピリジンー2ーイル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(134) 8ー（Nーブチルー Nーエチルアミノ）ー2ーメチルー3ー（2ーク

ロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(135) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(136) ８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、２

(137) ８－（Ｎ－ベンジル－Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、２

(138) ８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(139) ８－（Ｎ－（２－ブチニル）－Ｎ－エチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(140) ８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(141) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(142) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（３－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒ

ドロー５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(143) ８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２，５－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(144) ８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２，４－ジクロロフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(145) ８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（４－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(146) ８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（３－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(147) ８－ジプロピルアミノ－２－メチル－３－（２－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(148) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(149) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（ベンゾ［ｄ］１，３－ジオキソラン－５－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(150) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］

ピリミジン、

(151) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（3－メチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(152) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（4－メチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(153) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチルチオ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(154) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(155) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(156) 8－（N－ブチル－N－（2－ブチニル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(157) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－フルオロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(158) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジクロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(159) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，4－ジメトキ

シフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(160) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－フルオロ－4－メチルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(161) 8－（N－ブチル－N－（2－ブチニル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(162) 8－（3－メチル－2－ブチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(163) 8－（1－シクロヘキシルエチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(164) 8－（2－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(165) 8－（2－ヘプチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(166) 8－（1－メトキシ－2－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(167) 8－（2－オクチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(168) 8－（1，2，3，4－テトラヒドロナフタレン－1－イル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(169) 8－（（1S，2S，3S，5R）－2，6，6－トリメチルビシクロ［3．1．1］－3－ヘプチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(170) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－クロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(171) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジメトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(172) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(173) 8－（N－エチル－N－（4－ヒドロキシブチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(174) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシ－5－イソプロピルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(175) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシ－5－フルオロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(176) 8－（N－ブチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－

2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(177) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシ－5－クロロフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(178) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(179) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－シアノフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(180) 8－（N－プロピル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(181) 8－（N－エチル－N－（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(182) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（4－メチルチオフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(183) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（4－ジメチルアミノフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(184) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メチルチオフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラ

ゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(185) 8－（N－（2－メトキシエチル）－N－（2－ブチニル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(186) 8－（N－プロピル－N－（5－メチルフラン－2－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(187) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(188) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(189) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－ブロモフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(190) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジクロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(191) 8－ジブチルアミノ－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(192) 8－ビス（2－メトキシエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(193) 8－（N－エチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル

－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(194) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(195) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(196) 8－（N－ブチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(197) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－エトキシカルボニルフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(198) 8－（N－プロピル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(199) 8－（N－プロピル－N－（5－メチルチオフェン－2－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(200) 8－（N－プロピル－N－（チオフェン－3－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(201) 8－（N－エチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－

クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(202) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－カルバモイルフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(203) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－（Ｎ－メチルカルバモイル）フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(204) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルカルバモイル）フェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(205) ８－（Ｎ－エチル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(206) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４，６－ジメトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(207) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－アミノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(208) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メチルアミノフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(209) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－ホルミル－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(210) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－シアノ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(211) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－エチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(212) 8－（4－ヘプチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(213) 8－（N，N－ジプロピルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(214) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メトキシカルボニル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(215) 8－（N－シクロプロピル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(216) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(217) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－プロピルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(218) 8－（N－プロピル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－

3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(219) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(220) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(221) 8－（N－プロピル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(222) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(223) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(224) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(225) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(226) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒ

ドロー５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(227) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－（１－メチル－１－ヒドロキシエチル）－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(228) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(229) ８－（３－ヘキシルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(230) ８－（３－ペンチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メトキシ－４－メチルピリジン－５－イル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(231) ８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ）－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(232) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(233) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－シアノフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(234) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(235) 8－（N－エチル－N－n－ブチルアミノ）－2－ヒドロキシメチル－3－（2－メチル－4－ヒドロキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(236) 8－（N－エチル－N－n－ブチルアミノ）－2－ヒドロキシメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(237) 8－（N－プロピル－N－（2－メトキシイミノエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(238) 8－（N－エチル－N－n－ブチルアミノ）－2－ヒドロキシイミノメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(239) 8－［（2S）－1－ヒドロキシイミノブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(240) 8－［（1S）－1－シアノプロピルアミノ］－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(241) 8－（N－エチル－N－n－ブチルアミノ）－2－シアノ－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(242) 1－シアノ－2－メチル－8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピロロ［1，2－a］ピリミジン、

(243) 1－シアノ－2－メチル－8－ジプロピルアミノ－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］

ピロロ［1，2－a］ピリミジン、

(244) 2，3－ジメチル－4－アミノ－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジン、

(245) 2，3－ジメチル－4－エチルカルボニルアミノ－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジン、

(246) 2，3－ジメチル－4－プロピルアミノ－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジン、

(247) 2，3－ジメチル－4－（N－エチルカルボニル－N－プロピルアミノ）－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジン、

(248) 2，3－ジメチル－4－ジプロピルアミノ－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジン、

(249) 8－（4－ヘプチルアミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(250) 8－ジプロピルアミノ－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(251) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－プロピルアミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(252) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－3－（2，

6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(253) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－メチルフェニルメチル）アミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(254) 8－（N－プロピル－N－（4－フルオロフェニルメチル）アミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(255) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(256) 8－（N－ブチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(257) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(258) 2，3－ジメチル－4－（N－エチル－N－ペンチルアミノ）－1－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［e］ピロロ［2，3－b］ピリジンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

18．　化合物が、

(1) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロチエノ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(2) 9－（3－ペンチルアミノ）－6－メチル－5－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－2，3－ジヒドロ－チエノ［3，2－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(3) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(4) 9－（3－ペンチルアミノ）－6－メチル－5－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－2，3－ジヒドロ－フロ［3，2－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(5) 9－（3－ペンチルアミノ）－6－メチル－5－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－2，3－ジヒドロ－ピロロ［3，2－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(6) 8－イソプロピルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(7) 8－［（2S）－1，1－ジメトキシブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(8) 8－（1，3－ジメトキシプロパン－2－イル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(9) 8－ビス（2－メトキシエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(10)（5RS）－8－（3－ペンチルアミノ）－2，5－ジメチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］

ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(11) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－ピロロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(12) 8－（N－プロピル－N－（2－ヒドロキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(13) 8－シクロプロピルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(14) 8－(N－メチル－N－シクロプロピルアミノ)－2－メチル－3－(2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(15) 8－［（2R）－1－メトキシブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(16) 8－［（2R）－1－メトキシブタン－2－イル］アミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－2，3－ジヒドローフロ［3，2－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(17) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(18) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－エトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(19) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）

－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(20) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(21) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(22) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（４－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(23) ８－（Ｎ，Ｎ－ジプロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(24) ８－（Ｎ，Ｎ－ジブチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(25) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－メチルフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(26) ８－（Ｎ－ブチル－Ｎ－プロピルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(27) ８－（４－ヘプチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(28) 8－（N－ブチル－N－エチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(29) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(30) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(31) 8－（N－（2－ブチニル）－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(32) 8－（N－ブチル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(33) 8－（N－プロピル－N－（4－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(34) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(35) 8－(N－シクロプロピルメチルアミノ－N－(4－フルオロフェニル)メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(36) 8－（N－ベンジル－N－（2－ジメチルアミノエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、2

(37) 8－（N－（2－ブチニル）－N－エチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(38) 8－（N－（2－ブチニル）－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(39) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(40) 8－（N－プロピル－N－（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(41) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(42) 8－（N－プロピル－N－（3－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(43) 8－（N－プロピル－N－（ベンゾ［d］1，3－ジオキソラン－5－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(44) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル

－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(45) 8－（N－ブチル－N－（2－ブチニル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(46) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(47) 8－（N－ブチル－N－エチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(48) 8－（N－ブチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(49) 8－（N，N－ジプロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(50) 8－ビス（2－メトキシエチル）アミノ－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(51) 8－（N－ブチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(52) 8－（N－ブチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(53) 8－（N－エチル－N－（2－ブチリル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(54) 8－（N－プロピル－N－（2－ブチリル）アミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(55) 8－（N－プロピル－N－（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(56) 8－（N－プロピル－N－（ベンゾ［d］1，3－ジオキソラン－5－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(57) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(58) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(59) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(60) 8－（N－プロピル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ

ーフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(61) 8－（Nーシクロプロピルー Nー（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチルー3－（2－クロロー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(62) 8－（Nーシクロプロピルー Nー（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(63) 8－（Nーシクロプロピルメチルー Nー（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(64) 8－（Nーブロピルー Nー（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチルー3－（2－クロロー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(65) 8－（Nーブロピルー Nー（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(66) 8－（Nーエチルー Nー（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチルー3－（2－クロロー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(67) 8－（Nーエチルー Nー（4－メチルチオフェニル）メチルアミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(68) 8－（Nーブチルー Nー（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチルー3－（2－メチルー4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(69) 8－（Nーシクロプロピルメチルー Nーブロピルアミノ）－2－メチル

－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(70) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルフラン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(71) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（５－メチルフラン－２－イル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(72) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(73) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－トリフルオロメチルオキシフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(74) ８－（Ｎ－プロピル－Ｎ－（４－フルオロフェニル）メチルアミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(75) ８－（Ｎ－シクロプロピルメチル－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(76) ８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドローフロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(77) ８－（Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－（２－ブチニル）アミノ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒド

ローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(78) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(79) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(80) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（2－メトキシエチル）アミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(81) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，5－ジクロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(82) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(83) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(84) 8－ジブチルアミノ－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(85) 8－（N－エチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドローフロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(86) 8－（N－エチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－

3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(87) 8－(N－シクロプロピルメチル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(88) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(89) 8－（N－プロピル－N－（チオフェン－3－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(90) 8－（N－プロピル－N－（5－メチルチオフェン－2－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(91) 8－（N－ブチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(92) 8－（N－ブチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(93) 8－（N－プロピル－N－（チオフェン－3－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(94) 8－（N－プロピル－N－（5－メチルチオフェン－2－イル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(95) 8－（N－プロピル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(96) 8－（N－プロピル－N－（2－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(97) 8－（N－エチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(98) 8－（N－エチル－N－プロピルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(99) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2，6－ジメチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(100) 8－（N－エチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(101) 8－（N－エチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(102) 8－（3－ペンチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4，6－ジメトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(103) 8－（4－ヘプチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，

5－a］ピリミジン、

(104) 8－（N，N－ジプロピルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(105) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－プロピルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(106) 8－（N－ベンジル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(107) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(108) 8－（N－プロピル－N－（2－ブチニル）アミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(109) 8－（N－ブチル－N－シクロプロピルメチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(110) 8－（3－ペンチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(111) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(112) 8－（4－ヘプチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェ

ニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(113) 8－（N－プロピル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(114) 8－（N－プロピル－N－（4－フルオロフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(115) 8－ジシクロプロピルメチルアミノ－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(116) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(117) 8－（N－シクロプロピル－N－（4－メチルフェニル）メチルアミノ）－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(118) 8－（N－プロピル－N－（4－シアノフェニル）メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(119) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(120) 8－（N－シクロプロピルメチル－N－メチルアミノ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－5，7－ジヒドロ－フロ［3，4－d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(121) 8－（Nープロピルー Nー（2ーメトキシイミノエチル）アミノ）ー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー5，7ージヒドローフロ［3，4ーd］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(122) 8－［（2S）ー1ーメトキシイミノブタンー2ーイル］アミノー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー5，7ージヒドローフロ［3，4ーd］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(123) 9－（3ーペンチルアミノ）ー6ーメチルー5ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ーフロ［3，2ーd］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジンから選ばれる請求の範囲1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

19． 化合物が、

(1) 8ーヒドロキシー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(2) 2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー8ー［（2S，4R）ー4ーメトキシー2ーメトキシメチルピロリジンー1ーイル］ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(3) 8ー（1，2，5，6ーテトラヒドロピリジル）ー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(4) 8ー（1，2，3，4ーテトラヒドロイソキノリンー2ーイル）ー2ーメチルー3ー（2ーメチルー4ーメトキシフェニル）ー6，7ージヒドロー5Hーシクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5ーa］ピリミジン、

(5) 8ー（（3S）ー3ーメトキシメチルー1，2，3，4ーテトラヒドロ

イソキノリン－2－イル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(6) 8－（4－フェニルピペラジン－1－イル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、2

(7) 8－（4－（2－クロロフェニル）ピペラジン－1－イル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(8) 8－（3－エトキシカルボニル－1，2，5，6－テトラヒドロピリジル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(9) 8－（3－（3－メチル－1，2，4－オキサジアゾール－5－イル）－1，2，5，6－テトラヒドロピリジル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(10) 8－（4－（4－クロロフェニル）－1，2，5，6－テトラヒドロピリジル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(11) 8－（3－ペンチルオキシ）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(12) 8－（3－ペンチルオキシ）－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(13) 8－（4－ヘプチルオキシ）－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(14) 8－イソプロピルオキシ－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(15) 8－（1，6－ヘプタジエン－4－イル）オキシ－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(16) 8－（3－ペンチルチオ）－2－メチル－3－（2－クロロ－5－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(17) 8－（4－メチルフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(18) 8－（2，4－ジクロロフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(19) 8－（3－トリフルオロメチルフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(20) 8－（4－メトキシフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(21) 8－（3，5－ジクロロフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピ

ラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(22) 8－（2－メチルフェニル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(23) 8－ビス（エトキシカルボニル）メチル－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(24) 8－（1－ジメチルアミノ－1，3－ジオキソ－2－ブチル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(25) 8－（2，4－ジオキソ－3－ペンチル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(26) 8－ビス（エトキシカルボニル）メチル－2－メチル－3－（2－クロロ－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(27) 8－（1，3－ヒドロキシ－2－プロピル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(28) 8－（1，3－ジメトキシ－2－プロピル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(29) 8－（N，N－ジメチルカルバモイルメチル）－2－メチル－3－（2－メチル－4－メトキシフェニル）－6，7－ジヒドロ－5H－シクロペンタ［d］ピラゾロ［1，5－a］ピリミジン、

(30) 1－シアノ－2－メチル－8－ヒドロキシ－3－（2－クロロ－4－メ

トキシフェニル）－６，７－ジヒドロ－５Ｈ－シクロペンタ［ｄ］ピロロ［１，２－ａ］ピリミジンから選ばれる請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

２０．　化合物が、

(1) ６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－９－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－２，３－ジヒドロ－フロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(2) ２－メチル－３－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－８－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

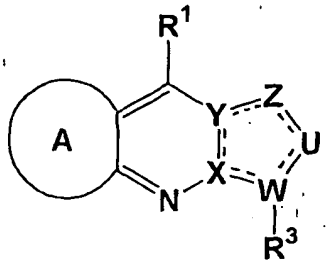
(3) ６－メチル－５－（２－メチル－４－メトキシフェニル）－９－［（２Ｓ，４Ｒ）－４－メトキシ－２－メトキシメチルピロリジン－１－イル］－２，３－ジヒドロ－ピロロ［３，２－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(4) ８－（３－ペンチルオキシ）－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン、

(5) ８－ビス（エトキシカルボニル）メチル－２－メチル－３－（２－クロロ－４－メトキシフェニル）－５，７－ジヒドロ－フロ［３，４－ｄ］ピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジンから選ばれる請求の範囲１に記載の化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物。

２１．　請求の範囲１に記載の一般式（Ｉ）で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水和物を含有する医薬品組成物。

２２．　一般式（Ｉ）



(I)

（式中、

ＸおよびＹはそれぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表わし（ただし、二つは同時に窒素原子を表わさない。）、

Ｗは炭素原子または窒素原子を表わし、

ＵおよびＺはそれぞれ独立して、ＣＲ^{2}、ＮＲ^{13}、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、Ｃ＝ＯまたはＣ＝Ｓを表わし、

Ｒ^{2}は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～８アルキル、

(iii)Ｃ２～８アルケニル、

(iv)Ｃ２～８アルキニル、

(v)ハロゲン原子、

(vi)ＣＦ$_{3}$、

(vii)シアノ、

(viii)ニトロ、

(ix)ＮＲ^{9}Ｒ^{10}（基中、Ｒ^{9}およびＲ^{10}はそれぞれ独立して、

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～４アルキル、

(iii)Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(iv)１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個

の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(v) Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、もしくは１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(x) OR^{11}（基中、R^{11}は

(i) 水素原子、

(ii) Ｃ１～４アルキル、

(iii) Ｃ５～６の炭素環、

(iv) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(v) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xi) ＳＨ、

(xii) $S(O)_nR^{12}$（基中、ｎは０、１または２を表わし、R^{12}は

(i) Ｃ１～４アルキル、

(ii) Ｃ５～６の炭素環、

(iii) １～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環、または

(iv) Ｃ５～６の炭素環もしくは１～２個の窒素原子、１個の酸素原子および／または１個の硫黄原子を含有する５または６員の複素環で置換されたＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii) COR^{11}、

(xiv) $COOR^{11}$、

(xv) $CONR^{9}R^{10}$、

(xvi) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(xvii) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(xviii) ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているC１～４アルキルを表わし、

R^{13}は

(i) 水素原子、

(ii) C１～４アルキル、

(iii) C２～４アルケニル、

(iv) C２～４アルキニル、

(v) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) １～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii) C３～１０の単環もしくは二環式炭素環で、または１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環で置換されているC１～４アルキルを表わし、

---- は単結合または二重結合を表わし、



はC１～４アルキル、C１～４アルコキシ、ハロゲン原子およびCF_3から選ばれる基１～３個で置換されているか、もしくは無置換のC４～６炭素環、または窒素原子、酸素原子または硫黄原子を少なくとも１個含有する４～６

員の複素環を表わし、

R^1は

(i) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC1～8アルキル、

(ii) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC2～8アルケニル、

(iii) 1～5個のR^{14}で置換されているかもしくは無置換のC2～8アルキニル、

(iv) NR^4R^5（基中、R^4およびR^5はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子、

(ii) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC1～15アルキル、

(iii) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルケニル、

(iv) 1～5個のR^{17}で置換されているかもしくは無置換のC2～15アルキニル、

(v) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環を表わす。）、

(v) OR^6（基中、R^6は

(i) 水素原子、

(ii) C1～10アルキル、

(iii) C2～10アルケニル、

(iv) C2～10アルキニル、

(v) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～15の

単環もしくは二環式炭素環、

(vi) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、および1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基1～2個で置換されているC1～4アルキルを表わす。）、

(vi) SH、

(vii) $S(O)_nR^7$（基中、nは前記と同じ意味を表わし、R^7は

(i) C1～8アルキル、

(ii) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環、

(iii) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環、または

(iv) 1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～10の単環もしくは二環式炭素環で、または1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～10員の単環もしくは二環式複素環で置換されたC1～4アルキルを表わす。）、

(viii) COR^6、

(ix) $COOR^6$、

(x) $CONR^4R^5$、

(xi) NR^8COR^6、

(xii) NR^8COOR^6（基中、R^6は前記と同じ意味を表わし、R^8は

(i)水素原子、

(ii)Ｃ１～８アルキル、

(iii)Ｃ２～８アルケニル、

(iv)Ｃ２～８アルキニル、

(v)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

(vi)１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(vii)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、SH、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）、

(xiii) $NR^8CONR^4R^5$、

(xiv)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または

(xv)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～

１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{14}は(a)ハロゲン原子、(b)CF_3、(c)OCF_3、(d)シアノ、(e)ニトロ、(f)NR^4R^5、(g)OR^6、(h)＝N－OR^6、(j)SH、(k)$S(O)_nR^7$、(l)COR^6、(m)$COOR^6$、(n)$CONR^4R^5$、(o)NR^8COR^6、(p)NR^8COOR^6、(q)$NR^8CONR^4R^5$、(r)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１５の単環もしくは二環式炭素環、または(s)１～５個のR^{15}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１５員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{15}は(a)Ｃ１～８アルキル、(b)Ｃ２～８アルケニル、(c)Ｃ２～８アルキニル、(d)Ｃ１～４アルコキシ（Ｃ１～４）アルキル、(e)ハロゲン原子、(f)CF_3、(g)OCF_3、(h)シアノ、(j)ニトロ、(k)NR^4R^5、(l)OR^6、(m)SH、(n)$S(O)_nR^7$、(o)COR^6、(p)$COOR^6$、(q)$CONR^4R^5$、(r)NR^8COR^6、(s)NR^8COOR^6、(t)$NR^8CONR^4R^5$、(u)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、(v)１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、(w)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^4R^5、OR^6、＝N－OR^6、SH、$S(O)_nR^7$、COR^6、$COOR^6$、$CONR^4R^5$、NR^8COR^6、NR^8COOR^6、$NR^8CONR^4R^5$、１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換のＣ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～５個のR^{20}で置換されているかもしくは無置換の１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わし、

R^{17}は(a)ハロゲン原子、(b)CF_3、(c) OCF_3、(d)シアノ、(e)ニトロ、

(f)NR^9R^{10}、(g)OR^{11}、(h)=N−OR^{11}、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)COR^{11}、(m)$COOR^{11}$、(n)$CONR^9R^{10}$、(o)NR^8COR^{11}、(p)NR^8COOR^{11}、(q)$NR^8CONR^9R^{10}$、(r)1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換のC3～15の単環もしくは二環式炭素環、または

(s)1～5個のR^{18}で置換されているかもしくは無置換の1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する3～15員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{18}は(a)C1～4アルキル、(b)C2～4アルケニル、(c)C2～4アルキニル、(d)ハロゲン原子、(e)CF_3、(f)OCF_3、(g)シアノ、(h)ニトロ、(j)SH、(k)$S(O)_nR^{12}$、(l)NR^9R^{10}、(m)OR^{11}、(n)COR^{11}、(o)$COOR^{11}$、(p)$CONR^9R^{10}$、(q)C5～6の炭素環、(r)1～2個の窒素原子、1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複素環、または(s)C5～6の炭素環または1～2個の窒素原子、1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含有する5または6員の複素環で置換されたC1～4アルキルで置換されたC1～4アルキル表わし、

R^{19}はC1～4アルキル、C1～4アルコキシ、ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、アミノ、NH（C1～4アルキル）、またはN（C1～4アルキル）$_2$を表わし、

R^3は(i)1～5個のR^{16}によって置換されているC5～10の単環もしくは二環式炭素環、または

(ii) 1～5個のR^{16}によって置換されている1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含有する5～10員の単環もしくは二環式複素環を表わし、

R^{16}は、

(a)C1～8アルキル、

(b)C2～8アルケニル、

(c)Ｃ２～８アルキニル、

(d)ハロゲン原子、

(e)CF_3、

(f)OCF_3、

(g)シアノ、

(h)ニトロ、

(j)NR^9R^{10}、

(k)OR^{11}、

(l)ＳＨ、

(m)$S(O)_nR^{12}$、

(n)COR^{11}、

(o)$COOR^{11}$、

(p)$CONR^9R^{10}$、

(q)NR^8COR^{11}、

(r)NR^8COOR^{11}、

(s)$NR^8CONR^9R^{10}$、

(t)Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、

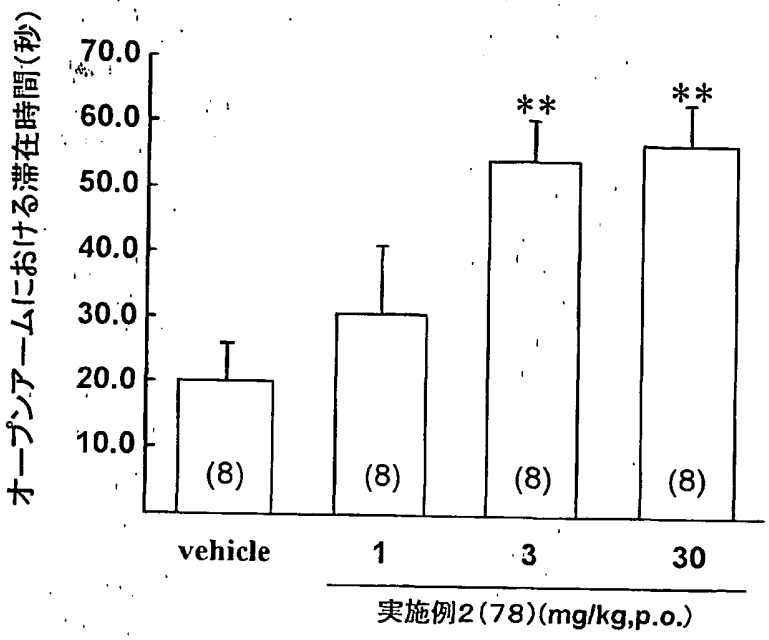
(u)１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環、または

(w)ハロゲン原子、CF_3、OCF_3、シアノ、ニトロ、NR^9R^{10}、OR^{11}、$=N-OR^{11}$、ＳＨ、$S(O)_nR^{12}$、COR^{11}、$COOR^{11}$、$CONR^9R^{10}$、NR^8COR^{11}、NR^8COOR^{11}、$NR^8CONR^9R^{10}$、Ｃ３～１０の単環もしくは二環式炭素環、および１～４個の窒素原子、１～２個の酸素原子および／または１～２個の硫黄原子を含有する３～１０員の単環もしくは二環式複素環から選ばれる基１～２個で置換されているＣ１～４アルキルを表わす。）で示される化合物、その薬学的に許容される塩またはそれらの水

和物を有効成分として含有するコルチコトロピン放出因子の分泌異常によって引き起こされる疾患の治療および／または予防剤。

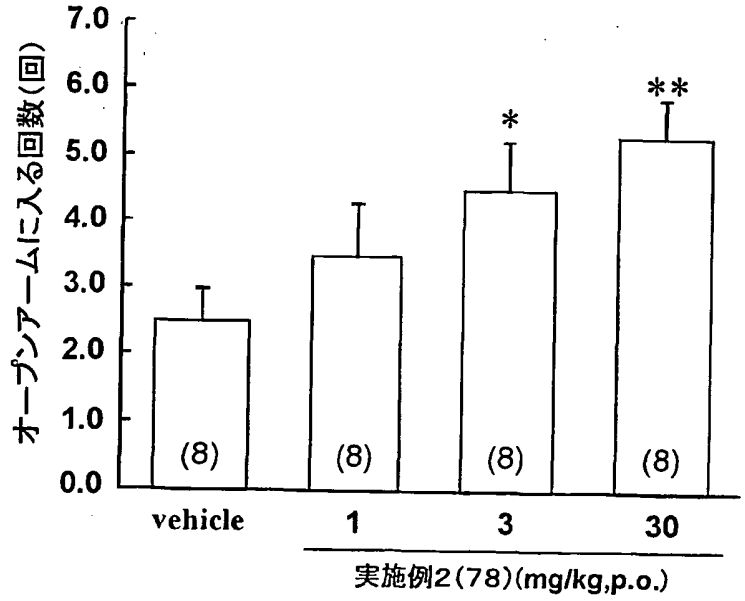
２３．　コルチコトロピン放出因子の分泌異常によって引き起こされる疾患が、うつ病、単一エピソードうつ病、再発性うつ病、分娩後うつ病、小児虐待誘発性うつ病、不安症、不安障害（パニック障害、特定の恐怖症、高所恐怖症、社会恐怖、強迫性障害）、感情障害、双極性障害、心的外傷後ストレス、消化性潰瘍、下痢、便秘、過敏性腸症候群、炎症性腸疾患（潰瘍性大腸炎、クローン病）、ストレスに伴う胃腸機能障害、神経性嘔吐、摂食異常（神経性食欲不振、過食症）、肥満症、ストレス誘発性睡眠障害、繊維筋痛性睡眠障害、ストレス誘導性免疫抑制、ストレス誘発性頭痛、ストレス誘発性熱、ストレス誘発性疼痛、手術襲撃ストレス、慢性関節リウマチ、変形性骨関節症、骨粗鬆症、乾癬、甲状腺機能障害症候群、ブドウ膜炎、喘息、不適切な抗下痢ホルモンに基づく症状、疼痛、炎症、アレルギー性疾患、頭部損傷、脊髄損傷、虚血性ニューロン損傷、分泌毒性ニューロン損傷、クッシング病、発作、痙攣、筋痙攣、てんかん虚血性疾患、パーキンソン病、ハンティングトン病、尿失禁、アルツハイマー病、アルツハイマー型老人性痴呆、多梗塞性痴呆症、筋萎縮性側索硬化症、低血糖症、心血管または心臓関連疾患（高血圧、頻脈、うっ血性心不全）、薬物またはアルコールの禁断症状である請求の範囲２２に記載の治療剤および／または治療剤。

図 1



**p<0.01 (Mann-Whitney U 検定)

図 2



*p<0.05, **p<0.01
(Mann-Whitney U 検定)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP01/11581

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(See extra sheet.)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
Int.Cl[7] C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS(STN), REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	Leach, Colin A., et al., "Reversible Inhibitors of the Gastric(H+/K+)-ATPase. 2. 1-Arylpyrrolo[3,2-c] quinolines: Effect of the 4-Substituent", J. Med. Chem.; Vol.35, No.10, 1992, Pages 1845 to 1852	1,5,6,8,17, 21-23 2-4,7,9-16, 18-20
X A	Sivakamasundari, S., et al., "Pyrroloquinolines. Part IV. Synthesis of 1-aryl-1H-pyrrolo[2,3-b] quinolines", Indian J. Chem., Sect.B, Vol.26B, No.8, 1987, pages 744 to 747	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23
X A	Smith, Leon, et al., "A Novel and highly efficient synthesis of the aza analogs of tacrine", Tetrahedron Lett., Vol.40, No.31, 1999, pages 5643 to 5646	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23
X A	Hirbert, Gerhard, et al., "(Aminoethinyl) metallierungen, 14. Cyclisierung von N^1, N^2-Diaryl-N^1-Phenacyl-3-aminopropiolamidinen", Liebigs Ann. Chem., (1985), (7), pages 1389 to 1397	1,5,6,8,17 2-4,7,9-16, 18-23

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier document but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
02 April, 2002 (02.04.02)	09 April, 2002 (09.04.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP01/11581

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO, 97/11946, A1 (Otsuka Pharmaceutical Factory, Inc.),	1-3,6,8-10, 17-23
A	03 April, 1997 (03.04.97), (Full text) & CA 2206080 A & EP 795555 A1 & CN 1169149 A & US 5843951 A	4,5,7,11-16
A	WO, 92/06096, A1 (Otsuka Pharmaceutical Factory, Inc.), 16 April, 1992 (16.04.92), (Full text) & AU 3877593 A & CN 1060844 A & EP 503099 A1 & JP 5-948 A & JP 5-112571 A & US 5420128 A	1-23

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP01/11581

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl[7] C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519, A61P1/00, 1/04, 1/08, 1/14, 3/04, 3/08, 5/14, 9/00, 9/02, 9/06, 9/10, 9/12, 11/06, 17/06, 19/02, 19/10, 25/00, 25/06, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 27/02, 29/00, 37/08, 43/00
(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

(Subject of search)

Claim 1 involves a great number of compounds in its scope. However, it is recognized that only small part of the claimed compounds are exclusively supported by the description under the provision of Article 6 of the PCT and disclosed therein under the provision of Article 5 of the PCT.

Therefore, the search has been practiced on the part supported by the description and disclosed therein, namely, the compounds of the general formula (I) wherein A is a 5-membered or 6-memebered carbon ring or heterocycle; the fused ring moiety other than A has a pyrazolo[1,5-a]pyrimidine structure, a pyrrolo[1,2-a]pyrimidine structure or a pyrrolo[2,3-b]pyrimidine structure; and R3 is a phenyl group or a pyridyl group.

The same applies to claims 2 to 23.

国際調査報告

国際出願番号 PCT／JP01／11581

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int. Cl' C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519, A61P1/00, 1/04, 1/08, 1/14, 3/04, 3/08, 5/14, 9/00, 9/02, 9/06, 9/10, 9/12, 11/06, 17/06, 19/02, 19/10, 25/00, 25/06, 25/08, 25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 27/02, 29/00, 37/08, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int. Cl' C07D471/04, 487/04, 487/14, 491/147, 495/14, A61K31/437, 31/519

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
X	Leach, Colin A., et al., 'Reversible Inhibitors of the Gastric(H+/K+)-ATPase. 2. 1-Arylpyrrolo[3,2-c]quinolines:	1,5,6,8,17 21-23
A	Effect of the 4-Substituent' J. Med. Chem., Vol. 35, No. 10, 1992, p. 1845-1852	2-4,7,9-16 18-20
X	Sivakamasundari, S., et al. 'Pyrroloquinolines. Part IV. Synthesis of 1-aryl-1H-pyrrolo[2,3-b]quinolines'	1,5,6,8,17
A	Indian J. Chem., Sect. B, Vol. 26B, No. 8, 1987, p. 744-747	2-4,7,9-16 18-23

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。 ☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊ 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
02. 04. 02	09.04.02

国際調査機関の名称及びあて先	特許庁審査官（権限のある職員）	
日本国特許庁（ISA／JP） 郵便番号100－8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	胡田 尚則	4P 7918
	電話番号 03－3581－1101 内線 3491	

様式PCT／ISA／210（第2ページ）（1998年7月）

C（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
X	Smith, Leon, et al., 'A Novel and highly efficient synthesis of the aza analogs of tacrine'	1,5,6,8,17
A	Tetrahedron Lett., Vol.40, No.31, 1999, p.5643-5646	2-4,7,9-16 18-23
X	Hirbert, Gerhard, et al., '(Aminoethinyl)metallierungen, 14. Cyclisierung von N^1,N^2-Diaryl-N^1-Phenacyl-3-	1,5,6,8,17
A	aminopropiolamidinen' Liebigs Ann. Chem., (1985),(7),p.1389-1397	2-4,7,9-16 18-23
X	WO 97/11946 A1 (株式会社大塚製薬工場) 1997.04.03 (全文参照) & CA 2206080 A & EP 795555 A1 & CN 1169149 A	1-3,6,8-10 17-23
A	& US 5843951 A	4,5,7,11-16
A	WO 92/06096 A1 (大塚製薬株式会社) 1992.04.16 (全文参照) & AU 3877593 A &CN 1060844 A & EP 503099 A1 & JP 5-948 A & JP 5-112571 A & US 5420128 A	1-23

（発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））の続き）
//(C07D487/14, 207:00, 231:00, 239:00) (C07D491/147, 231:00, 239:00, 307:00)
(C07D495/14, 231:00, 239:00, 333:00)

（調査の対象について）
請求の範囲１は非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、ＰＣＴ第６条の意味において明細書に裏付けられ、また、ＰＣＴ第５条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分に過ぎない。
よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、一般式（Ｉ）において、Ａが５員若しくは６員の炭素環若しくは複素環であり、Ａ以外の縮合環部分がピラゾロ［１，５－ａ］ピリミジン構造、ピロロ［１，２－ａ］ピリミジン構造又はピロロ［２，３－ｂ］ピリジン構造を有し、Ｒ３がフェニル基又はピリジル基であるものについて行った。
請求の範囲２－２３についても同様である。